# INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation 6:

C07C 237/44, 235/58, 235/64, 235/62, A01N 37/18, 37/24

(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 97/08135

(43) Internationales

Veröffentlichungsdatum:

6. März 1997 (06.03.97)

(21) Internationales Aktenzeichen:

PCT/EP96/03637

(22) Internationales Anmeldedatum: 19. August 1996 (19.08.96)

(30) Prioritätsdaten:

195 31 891.9 30. August 1995 (30.08.95) DE 196 15 453.7 19. April 1996 (19.04.96) DE 196 26 311.5 1. Juli 1996 (01.07.96) DE (81) Bestimmungsstaaten: AU, BB, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, HU, JP, KR, KZ, LK, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SK, TR, UA, US, europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BAYER
AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-51368 Leverkusen

(72) Erfinder; und

(DE).

- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): SEITZ, Thomas [DE/DE]; Rietherbach 10b, D-40764 Langenfeld (DE). NAUMANN, Klaus [DE/DE]; Richard-Wagner-Strasse 9, D-51375 Leverkusen (DE). TIEMANN, Ralf [DE/DE]; Ernst-Ludwig-Kirchner-Strasse 5, D-51375 Leverkusen (DE). STENZEL, Klaus [DE/DE]; Seesener Strasse 17, D-40595 Düsseldorf (DE). HÄNSSLER, Gerd [DE/DE]; Am Arenzberg 58a, D-51381 Leverkusen (DE). DUTZMANN, Stefan [DE/DE]; Kosenberg 10, D-40721 Hilden (DE).
- (74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER AKTIENGE-SELLSCHAFT; D-51368 Leverkusen (DE).

#### Veröffentlicht

Mit internationalem Recherchenbericht.

- (54) Title: ACYLAMINOSALICYLIC ACID AMIDES AND THEIR USES AS PESTICIDES
- (54) Bezeichnung: ACYLAMINOSALICYLSÄUREAMIDE SCHÄDLINGSBEKÄMPFUNGSMITTEL

UND

IHRE

VERWENDUNG

ALS

(57) Abstract

Known and new acylaminosalicylic acid amides are disclosed having the general formula (I), as well as several processes for producing the same, their use as pesticides, new intermediate products and several processes for preparing said intermediate products. In the formula (I), A stands for a simple bond or for an alkylene chain; R¹ stands for hydrogen, alkyl or alkoxy; R² stands for optionally substituted cycloalkyl, cycloalkenyl, aryl or heterocyclyl.

$$\mathbb{R}^1$$
  $\mathbb{N}$   $\mathbb{R}^2$   $\mathbb{R}^2$   $\mathbb{R}^2$ 

#### (57) Zusammenfassung

Die Erfindung betrifft bekannte und neue Acylaminosalicylsäureamide der allgemeinen Formel (I), mehrere Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel, sowie neue Zwischenprodukte und mehrere Verfahren zu deren Herstellung, in welcher A für eine Einfachbindung oder für eine Alkylenkette steht, R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxy steht, R<sup>2</sup> für jeweils gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Aryl oder Heterocyclyl steht.

### LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AM	Armenien	GB	Vereinigtes Königreich	MX	Mexiko
AΤ	Österreich	GE	Georgien	NE	Niger
$\mathbf{AU}$	Australien	GN	Guinea	NL	Niederlande
BB	Barbados	GR	Griechenland	NO	Norwegen
BE	Belgien	HU	Ungarn	NZ	Neuseeland
$\mathbf{BF}$	Burkina Faso	ľΕ	Irland	PL	Polen
$\mathbf{BG}$	Bulgarien	IT	Italien	PT	Portugal
ВJ	Benin	JP	Japan	RO	Rumänien
BR	Brasilien	KE	Kenya	RU	Russische Föderation
BY	Belarus	KG	Kirgisistan	SD	Sudan
CA	Kanada	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	SE	Schweden
CF	Zentrale Afrikanische Republik	KR	Republik Korea	SG	Singapur
CG	Kongo	KZ	Kasachstan	SI	Slowenien
CH	Schweiz	LI	Liechtenstein	SK	Slowakei
CI	Côte d'Ivoire	LK	Sri Lanka	SN	Senegal
CM	Kamerun	LR	Liberia	SZ	Swasiland
CN	China	LK	Litauen	TD	Tschad
CS	Tschechoslowakei	LU	Luxemburg	TG	Togo
CZ	Tschechische Republik	LV	Lettland	TJ	Tadschikistan
DE	Deutschland	MC	Monaco	TT	Trinidad und Tobago
DK	Dänemark	MD	Republik Moldau	UA	Ukraine
EE	Estland	MG	Madagaskar	UG	Uganda
ES	Spanien	ML	Mali	US	Vereinigte Staaten von Amerika
FI	Finnland	MN	Mongolei	UZ	Usbekistan
FR	Frankreich	MR	Mauretanien	VN	Vietnam
GA	Gabon	MW	Malawi		Culan

## ACYLAMINOSALICYLSÄUREAMIDE UND IHRE VERWENDUNG ALS SCHÄDLINGSBEKÄMPFUNGSMITTEL

Die Erfindung betrifft bekannte und neue Acylaminosalicylsäureamide, mehrere Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel. Die vorliegende Anmeldung betrifft weiterhin neue Zwischenprodukte, mehrere Verfahren zu deren Herstellung und deren Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel.

Bestimmte Acylaminosalicylsäureamide, wie beispielsweise die Verbindungen 3-Formamido-salicylanilid und 3-(Formylamino)-2-hydroxy-N-(phenylmethyl)-benzamid, sind bereits bekannt (vergleiche z. B. Biochim. Biophys. Acta (1993), 1142(3), 262-8, J. Med. Chem. (1990), 33(1), 136-42 oder J. Biol. Chem. (1971), 246(23), 7125-30).

Eine Wirkung gegen Schädlinge ist von diesen vorbekannten Verbindungen bisher jedoch nicht beschrieben.

Es wurde nun gefunden, daß die Acylaminosalicylsäureamide der allgemeinen Formel (I),

$$R^1$$
  $N$   $N$   $R^2$   $N$ 

in welcher

20 A für eine Einfachbindung oder für eine Alkylenkette steht,

R1 für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxy steht,

R<sup>2</sup> für jeweils gegebenenfalls substituiertes Cyloalkyl, Cycloalkenyl, Aryl oder Heterocyclyl steht,

sich zur Bekämpfung von Schädlingen an Pflanzen und technischen Materialien, vorzugsweise Pilzen, Insekten und Bakterien, eignen.

10

15

20

25

In den Definitionen sind die Kohlenwasserstoffketten, wie Alkyl, Alkylen, Alkenyl oder Alkinyl, auch in Verknüpfung mit Heteroatomen, wie in Alkoxy, Alkylthio oder Alkylamino, jeweils geradkettig oder verzweigt.

Halogen steht im allgemeinen für Fluor, Chlor, Brom oder Iod, vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom, insbesondere für Fluor oder Chlor.

Aryl steht für aromatische, mono oder polycyclische Kohlenwasserstoffringe, wie z.B. Phenyl, Naphthyl, Anthranyl, Phenanthryl, vorzugsweise für Phenyl oder Naphthyl, insbesondere für Phenyl.

Heterocyclyl steht für gesättigte oder ungesättigte, sowie aromatische, ringförmige Verbindungen mit bis zu acht Ringgliedern, in denen mindestens ein Ringglied ein Heteroatom, d. h. ein von Kohlenstoff verschiedenes Atom, ist. Enthält der Ring mehrere Heteroatome, können diese gleich oder verschieden sein. Heteroatome sind bevorzugt Sauerstoff, Stickstoff oder Schwefel. Gegebenenfalls bilden die ringförmigen Verbindungen mit weiteren carbocyclischen oder heterocyclischen, ankondensierten oder überbrückten Ringen gemeinsam ein polycyclisches Ringsystem. Bevorzugt sind mono- oder bicyclische Ringsysteme, insbesondere mono- oder bicyclische, aromatische Ringsysteme.

Cycloalkyl steht für gesättigte, carbocyclische, ringförmige Verbindungen, die gegebenenfalls mit weiteren carbocyclischen, ankondensierten oder überbrückten Ringen ein polycyclisches Ringsystem bilden.

Cycloalkenyl steht für carbocyclische, ringförmige Verbindungen, die mindestens eine Doppelbindung enthalten und gegebenenfalls mit weiteren carbocyclischen, ankondensierten oder überbrückten Ringen ein polycyclisches Ringsystem bilden.

Ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Anmeldung sind neue Acylaminosalicylsäureamide der allgemeinen Formel (I),

$$R^1$$
  $N$   $A$   $R^2$   $(I)$ 

15

in welcher

A für eine Einfachbindung oder für gegebenenfalls substituiertes Alkylen steht,

R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxy steht,

5 R<sup>2</sup> für jeweils gegebenenfalls substituiertes Cyloalkyl, Cycloalkenyl, Aryl oder Heterocyclyl steht, wobei die Nitrogruppe als Substituent ausgenommen ist,

und die Verbindungen 3-(Formylamino)-2-hydroxy-N-{4-[2,4,6-tris-(1-methyl-propyl)-phenoxy]-phenyl}-benzamid, N-{4-[3,5-Bis-(1,1-dimethylethyl)-phenoxy]-phenyl}-3-(formylamino)-2-hydroxy-benzamid, N-{4-[2,4-Bis-(1,1-dimethylethyl)-phenoxy]-phenyl}-3-(formylamino)-2-hydroxy-benzamid, N-{4-[2,6-Bis-(1-methyl-propyl)-phenoxy]-phenyl}-3-(formylamino)-2-hydroxy-benzamid, 3-(Formylamino)-2-hydroxy-N-{4-[3-(trifluormethyl)-phenoxy]-phenyl}-benzamid, N-{4-[4-(1,1-dimethylethyl)-phenoxy]-phenyl}-3-(formylamino)-2-hydroxy-N-(4-phenoxyphenyl)-benzamid, N-(4-Butylphenyl)-3-(formylamino)-2-hydroxy-benzamid und N-{3-chlor-4-(4-chlorphenoxy)phenyl}-3-(formylamino)-2-hydroxy-benzamid, 3-(Formylamino)-2-hydroxy-N-(phenylmethyl)-benzamid, 3-Formamido-salicylanilid und 3-(Formylamino)-2-hydroxy-N-(2-phenylethyl)-benzamid, ausgenommen sind.

Weiterhin wurde gefunden, daß man die neuen Acylaminosalicylsäureamide der allgemeinen Formel (I) erhält, wenn man

a) Aminosalicylsäureamide der allgemeinen Formel (II),

$$H_2N$$
  $A$   $R^2$  (II)

in welcher

A und R<sup>2</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

10

15

mit Acylierungsmitteln der allgemeinen Formel (III),

$$R^1$$
 (III)

in welcher

R<sup>1</sup> die oben angegebene Bedeutung hat und

X<sup>1</sup> für Halogen, Hydroxy, Alkoxy oder Alkylcarbonyloxy steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors, und gegebenenfalls in Gegenwart eines weiteren Reaktionshilfsmittels, umsetzt, oder wenn man

b) Nitrosalicylsäureamide der allgemeinen Formel (IV)

$$O_2N$$
 $N$ 
 $R^2$ 
(IV)

in welcher

A und R<sup>2</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Ameisensäure, gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators und gegebenenfalls in Gegenwart eines weiteren Reaktionshilfsmittels, umsetzt, oder wenn man

c) O-Benzyl-nitrosalicylsäureamide der allgemeinen Formel (V),

10

$$O_2N$$
 $N$ 
 $R^2$ 
 $(V)$ 

in welcher

A und R<sup>2</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Ameisensäure, gegebenenfalls in Gegenwart von Wasserstoff oder eines unedlen Metalls, gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators und gegebenenfalls in Gegenwart eines weiteren Reaktionshilfsmittels, umsetzt.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen liegen gegebenenfalls als Mischungen verschiedener möglicher isomerer Formen, insbesondere von Stereoisomeren, wie z. B. E- und Z-, threo- und erythro-, sowie optischen Isomeren vor. Es werden sowohl die E- als auch die Z-Isomeren, wie auch die threo- und erythro-, sowie die optischen Isomeren sowie beliebige Mischungen dieser Isomeren beansprucht.

Bevorzugt ist die Verwendung der Verbindungen, bzw. bevorzugt sind die neuen Verbindungen der Formel (I), in welcher

- A für eine Einfachbindung oder für eine Alkylenkette mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,
  - R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,
- für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Cyano, Carboxy, Phenyl (welches gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy substituiert ist), C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-

carbonyl substituiertes Cycloalkyl oder Cycloalkenyl mit 3 bis 12 Kohlenstoffatomen;

5

für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes Aryl mit 3 bis 12 Ringgliedern oder für Heterocyclyl mit 3 bis 8 Ringgliedern steht, wobei die möglichen Substituenten vorzugsweise aus der nachstehenden Aufzählung ausgewählt sind:

Halogen, Cyano, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl;

10

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;

15

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

20

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Acylamino, N-Acyl-N-alkylamino, Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxy-carbonyl, Alkylsulfonyloxy, Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen;

25

jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Alkylen oder Dioxyalkylen mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen;

sowie jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch

Halogen, Cyano, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl:

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen:

10 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

> jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

> jeweils geradkettiges oder verzweigtes Acylamino, N-Acyl-N-alkylamino, Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyl, Alkylsulfonyloxy, Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen;

> jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Alkylen oder Dioxyalkylen mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen;

5

15

20

substituiertes Aryl, Aryloxy, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxy, Arylalkylthio, Aryloxyalkyl, Arylthioalkyl, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, Heterocyclylalkyl, Heterocyclylalkyloxy oder Heterocyclylalkylthio.

- Die Erfindung betrifft insbesondere die Verwendung der Verbindungen, bzw. die neuen Verbindungen der Formel (I), in welcher
  - A für eine Einfachbindung oder für Methylen, 1,1-Ethylen, 1,2-Ethylen 1,1-, 1,2-, 1,3- oder 2,2-Propylen, 1,1-, 1,2-, 1,3-, 1,4-, 2,2-, 2,3-Butylen oder 1,1-, 1,2- oder 1,3-(2-Methyl-propylen) steht,
- 10 R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy steht,
  - R<sup>2</sup> für jeweils gegebenenfalls einfach bis sechsfach durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Carboxy, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propyl, Methoxy-carbonyl oder Ethoxy-carbonyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl, Cyclooctyl, Cyclononyl, Cyclodecyl, Cycloundecyl, Cyclododecyl, Tetralinyl, Decalinyl, Cyclododecatrienyl, Indanyl, Norbornyl oder Adamantyl;
- oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach substituiertes Phenyl, Naphthyl, Benzyl, Phenethyl, Furyl, Benzofuranyl, Pyrrolyl, Indolyl, Thienyl, Benzothienyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Thiazolyl, Isothiazolyl, Oxadiazolyl, Thiadiazolyl, Pyridyl, Chinolyl, Pyrimidyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl, Oxiranyl, Oxetanyl, Tetrahydrofuryl, Perhydropyranyl, Pyrrolidinyl, Piperidinyl oder Morpholinyl steht, wobei die möglichen Substituenten vorzugsweise aus der nachstehenden Aufzählung ausgewählt sind:
- Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Trifluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethyl-

sulfonyl, Acetylamino, Formylamino, N-Formyl-N-methylamino, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl, oder Ethoximinoethyl,

jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Tetramethylen (Butan-1,4-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

und/oder gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Formyl, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Formylamino, N-Formyl-N-methylamino, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl oder Ethoximinoethyl,

jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Tetramethylen (Butan-1,4-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

substituiertes Phenyl, Phenoxy, Phenylalkyl, Phenylthio, Phenoxyalkyl, Phenylthioalkyl, Phenylalkyloxy oder Phenylalkylthio, mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den jeweiligen Alkylketten.

10

5

15

20

25

10

15

Besonders bevorzugt ist die Verwendung der Verbindungen, bzw. sind die neuen Verbindungen der Formel (I), in welcher

- A für eine Einfachbindung oder für Methylen, 1,1-Ethylen, 1,2-Ethylen 1,1-, 1,2-, 1,3- oder 2,2-Propylen, 1,1-, 1,2-, 1,3-, 1,4-, 2,2-, 2,3-Butylen oder 1,1-, 1,2- oder 1,3-(2-Methyl-propylen) steht,
- R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy steht,
- R<sup>2</sup> für jeweils gegebenenfalls einfach bis sechsfach durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Carboxy, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propyl, Methoxy-carbonyl oder Ethoxy-carbonyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclohetyl, Cyclooctyl, Cyclononyl, Cyclodecyl, Cycloundecyl, Cyclododecyl, Tetralinyl, Decalinyl, Cyclododecatrienyl, Indanyl, Norbornyl oder Adamantyl:

für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach substituiertes Phenyl, Naphthyl, Benzyl, Phenethyl, Furyl, Benzofuranyl, Pyrrolyl, Indolyl, Thienyl, Benzothienyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Thiazolyl, Isothiazolyl, Oxadiazolyl, Thiadiazolyl, Pyridyl, Chinolyl, Pyrimidyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl, Oxiranyl, Oxetanyl, Tetrahydrofuryl, Perhydropyranyl, Pyrrolidinyl, Piperidinyl oder Morpholinyl steht, wobei die möglichen Substituenten vorzugsweise aus der nachstehenden Aufzählung ausgewählt sind:

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Formyl, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluormethoxy, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Formylamino, N-Formyl-N-methylamino, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl oder Ethoximinoethyl,

jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Tetramethylen (Butan-1,4-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

5 Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

und/oder gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Formyl, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Formylamino, N-Formyl-N-methylamino, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl oder Ethoximinoethyl,

jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Tetramethylen (Butan-1,4-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

substituiertes Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Benzyl, Phenylethyl, Phenylpropyl, Benzyloxy, Benzylthio, Phenoxymethyl, Phenoxyethyl, Phenylthiomethyl oder Phenylthioethyl.

Ganz besonders bevorzugt ist die Verwendung der Verbindungen, bzw. sind die neuen Verbindungen der Formel (I), in welcher

A für eine Einfachbindung oder für Methylen, 1,1-Ethylen, 1,2-Ethylen, 1,1-Propylen, 1,2-Propylen oder 2,2-Propylen steht,

10

15

20

R<sup>1</sup> für Wasserstoff steht,

R<sup>2</sup> für jeweils gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclohexyl, Cyclooctyl, Cyclononyl, Cyclodecyl, Cycloundecyl, Cyclododecyl, Tetralinyl, Decalinyl, Cyclododecatrienyl, Indanyl, Norbornyl oder Adamantyl;

für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach substituiertes Phenyl, Naphthyl, Furyl, Benzofuranyl, Pyrrolyl, Indolyl, Thienyl, Benzothienyl, Pyridyl, Chinolyl, Pyrimidyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl steht, wobei die möglichen Substituenten vorzugsweise aus der nachstehenden Aufzählung ausgewählt sind:

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluormethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Formylamino, N-Formyl-N-methylamino, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl oder Ethoximinoethyl,

jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Tetramethylen (Butan-1,4-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

und/oder gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Formyl, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluorethyl, Trifluorethyl,

10

5

15

20

25

10

20

Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Formylamino, N-Formyl-N-methylamino, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl oder Ethoximinoethyl.

jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Tetramethylen (Butan-1,4-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

substituiertes Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Benzyl, Phenyl-1-ethyl, Phenyl-2-ethyl, Benzyloxy, Benzylthio, Phenoxymethyl oder Phenylthiomethyl.

Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen angegebenen Restefinitionen gelten sowohl für die Endprodukte der Formel (I) als auch entsprechend
für die jeweils zur Herstellung benötigten Ausgangsstoffe bzw. Zwischenprodukte.

Diese Restedefinitionen können untereinander, also auch zwischen den angegebenen Bereichen bevorzugter Verbindungen, beliebig kombiniert werden.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens a) als Ausgangsstoffe benötigten Aminosalicylsäureamide sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel (II) haben A und R<sup>2</sup> vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für A und R<sup>2</sup> angegeben wurden.

Die Ausgangsstoffe der Formel (II) sind mit Ausnahme von 4-{4-[(3-Amino-2-hydroxybenzoyl)-amino]-3-hydroxy-1-piperidyl}-N,N,4-trimethyl-2,2-diphenyl-butanamid neu und ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Anmeldung.

Die Aminosalicylsäureamide der Formel (II) werden erhalten, wenn man (Verfahren a-la) Nitrosalicylsäureamide der allgemeinen Formel (IV),

10

$$O_2N$$
 $N$ 
 $A$ 
 $R^2$ 
(IV)

in welcher

A und R<sup>2</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Wasserstoff, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, vorzugsweise eines Esters wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; eines Alkohols, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, n-, i-, sek- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether; Wasser, einer Salzlösung, wie beispielsweise Ammoniumchloridlösung, einer Säure, wie beispielsweise Salzsäure oder Essigsäure, sowie beliebigen Mischungen der genannten Verdünnungsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, wie beispielsweise Raney-Nickel, Palladium oder Platin, gegebenenfalls auf einem Trägermaterial, wie Aktivkohle, umsetzt,

oder wenn man (Verfahren a-1b) O-Benzyl-nitrosalicylsäureamide der allgemeinen Formel (V),

$$O_2N \longrightarrow P \longrightarrow R^2$$

$$(V)$$

in welcher

A und R<sup>2</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

15

20

mit Wasserstoff, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, vorzugsweise eines Esters wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; eines Alkohols, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, n-, i-, sek- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylengly-kolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether; einer Säure, wie beispielsweise Essigsäure; Wasser; sowie beliebigen Mischungen der genannten Verdünnungsmittel und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, wie beispielsweise Raney-Nickel, Palladium oder Platin, gegebenenfalls auf einem Trägermaterial, wie beispielsweise Aktivkohle, umsetzt.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens a-1a) als Ausgangsstoffe benötigten Nitrosalicylsäureamide der Formel (IV) werden weiter unten im Zusammenhang mit der Beschreibung des erfindungsgemäßen Verfahrens b) beschrieben.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens a-1b) als Ausgangsstoffe benötigten O-Benzyl-nitrosalicylsäureamide sind durch die Formel (V), allgemein definiert. In dieser Formel (V) haben A und R<sup>2</sup> vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für A und R<sup>2</sup> angegeben wurden.

Die O-Benzyl-nitrosalicylsäureamide der Formel (V) sind noch nicht bekannt, sie sind als neue Stoffe Gegenstand der vorliegenden Anmeldung.

Die O-Benzyl-nitrosalicylsäureamide der Formel (V) werden erhalten, wenn man (Verfahren a-2) O-Benzyl-nitrosalicylsäurederivate der Formel (VI),

$$O_2N$$
 (VI)

in welcher

15

20

25

30

X<sup>2</sup> für Halogen, Hydroxy oder Alkoxy steht,

mit einem Amin der Formel (VII),

 $H_2N-A-R^2$  (VII)

in welcher

5 A und R<sup>2</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, vorzugsweise eines aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Kohlenwasserstoffes, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; eines halogenierten Kohlenwasserstoffes, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; eines Ethers, wie Diethylether, Diisopropylether, Methylt-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2- Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; eines Ketons, wie Aceton, Butanon, Methyl-isobutylketon oder Cyclohexanon; eines Nitrils, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; eines Amids, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; eines Esters wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; eines Sulfoxids, wie Dimethylsulfoxid; oder eines Sulfons, wie Sulfolan, gegebenenfalls in Gegenwart eines Kondensationsmittel, beispielsweise eines Säurehalogenidbildners wie Phosgen, Phosphortribromid, Phosphortrichlorid, Phosphorpentachlorid, Phosphoroxychlorid oder Thionylchlorid; eines Anhydridbildners wie Chlorameisensäureethylester, Chlorameisensäuremethylester, Chlorameisensäureisopropylester, Chlorameisensäureisobutylester oder Methansulfonylchlorid; eines Carbodiimides, wie N,N'-Dicyclohexylcarbodiimid (DCC) oder eines anderen üblichen Kondensationsmittels, wie Phosphorpentoxid, Polyphosphorsäure, N,N'-Carbonyldiimidazol, 2-Ethoxy-N-ethoxycarbonyl-1,2-dihydrochinolin (EEDQ) oder Triphenylphosphin/Tetrachlorkohlenstoff und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors, vorzugsweise eines Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydrides, -hydroxides, -amids, -alkoholates, -acetates, -carbonates oder -hydrogencarbonates, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natri-

10

25

umcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Ammoniumcarbonat, oder eines tertiären Amines, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU), umsetzt.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens a-2) als Ausgangsstoffe benötigten O-Benzyl-nitrosalicylsäurederivate sind durch die Formel (VI), allgemein definiert. In dieser Formel (VI) steht  $X^2$  für Halogen, vorzugsweise Chlor, Hydroxy oder Alkoxy, vorzugsweise Methoxy oder Ethoxy.

Die O-Benzyl-nitrosalicylsäurederivate der Formel (VI) sind bekannt und können nach bekannten Methoden hergestellt werden (vergleiche z. B. J. Am. Chem. Soc. 1959, 5215-5217).

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens a-2) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Amine sind durch die Formel (VII) allgemein definiert. In dieser Formel (VII) haben A und R<sup>2</sup> vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für A und R<sup>2</sup> angegeben wurden.

Die Amine der Formel (VII) sind bekannte Reagentien in der organischen Chemie.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens a) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Acylierungsmittel sind durch die Formel (III), allgemein definiert. In dieser Formel (III) hat R<sup>1</sup> vorzugsweise bzw. insbesondere diejenige Bedeutung, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R<sup>1</sup> angegeben wurde. X<sup>1</sup> steht für Halogen, Hydroxy, Alkoxy oder Alkylcarbonyloxy, vorzugsweise für Chlor, Hydroxy, Methoxy, Ethoxy oder Acetoxy.

Die Acylierungsmittel der allgemeinen Formel (III) sind bekannte Reagenzien in der organischen Chemie.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens b) als Ausgangsstoffe benötigten Nitrosalicylsäureamide sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In dieser Formel (IV) haben A und R<sup>2</sup> vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für A und R<sup>2</sup> angegeben wurden.

Die Nitrosalicylsäureamide der Formel (IV) sind teilweise bekannt und/oder können nach bekannten Methoden hergestellt werden (vergleiche z. B. Arzneim.-Forsch (1978), 28(9), 1550-3).

Neu, und auch Gegenstand der vorliegenden Anmeldung sind Nitrosalicylsäureamide der Formel (IV-a),

$$O_2N$$
 $N$ 
 $Z$ 
 $R^3$ 
(IV-a)

in welcher

- Z für eine Einfachbindung oder für eine Alkylenkette steht und
- 15 R<sup>3</sup> für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Aryl oder Heteroaryl mit bis zu 3 Heteroatomen, wobei die Nitrogruppe als Substituent ausgenommen ist, steht,

und die Verbindungen

N-[3-Chlor-4-(4-chlorphenoxy)phenyl]-2-hydroxy-3-nitro-benzamid,

N-(4-Decylphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid,

N-(3,4-Dimethylphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid,

3-Nitro-N-phenethyl-salicylamid,

N-Benzyl-3-nitro-salicylamid,

N-(4-Aminophenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid,

- N-(2-Chlor-6-methylphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid,
- N-(3-Chlor-2-methylphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid,
- 2-Hydroxy-3-nitro-N-(2,4,6-trichlorphenyl)-benzamid,
- N-(2,3-Dimethylphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid,
- 5 N-(2-Ethylphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid.
  - 2-Hydroxy-3-nitro-N-phenyl-benzamid,
  - 2-Hydroxy-N-(4-methylphenyl)-3-nitro-benzamid,
  - 2-Hydroxy-N-(2-methylphenyl)-3-nitro-benzamid,
  - 2-Hydroxy-N-(4-methoxyphenyl)-3-nitro-benzamid,
- 2-Hydroxy-N-(2-methoxyphenyl)-3-nitro-benzamid,
  - 2-Hydroxy-N-(2-hydroxyphenyl)-3-nitro-benzamid,
  - 2-Hydroxy-N-(2-hydroxyphenyl)-3-nitro-benzamide,
  - 2-[(2-Hydroxy-3-nitrobenzoyl)amino]-benzoesäure.
  - N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid,
- 15 N-(2,5-Dimethylphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid,
  - 2-Hydroxy-3-nitro-N-[2-phenoxy-5-(trifluormethyl)phenyl]-benzamid,
  - N-[2-Chlor-5-(trifluormethyl)phenyl]-2-hydroxy-3-nitro-benzamid,
  - 2-Hydroxy-3-nitro-N-[4-(phenylazo)phenyl]-benzamid,
  - N-(2,4-Dimethylphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid,
- N-(5-Chlor-2-methoxyphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid,
  - N-(4-Chlor-2-methylphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid,
  - N-(2-Chlor-4-methylphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid,
  - N-(4-Brom-2-methylphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid,
  - N-(4-Chlor-2,5-dimethoxyphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid,
- N-(2,5-Dibromphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid,
  - N-(2-Fluorphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid,
  - N-(3-Fluorphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid,
  - 2-Hydroxy-N-(2-iodphenyl)-3-nitro-benzamid,

2-Hydroxy-N-(3-iodphenyl)-3-nitro-benzamid. N-(2-Bromphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid, N-(3-Bromphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid, N-(2,5-Dichlorphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid, 5 N-(3,4-Dichlorphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid, 2',3',5'-Trichlor-6'-hydroxy-3-nitro-salicylanilid, N-(p-Hydroxy-a-methylphenethyl)-3-nitro-salicylamid. 3-Nitro-3',5'-bis(trifluormethoxy)-salicylanilid, N-(2,4-Dichlorphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid, 10 2-Hydroxy-N-(4-iodphenyl)-3-nitro-benzamid, N-(4-bromphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid, N-(2-Chlorphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid, N-(3-Chlorphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid, N-(4-Chlorphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid und 15 N-(4-Fluorphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid ausgenommen sind.

Die Nitrosalicylsäureamide der Formel (IV-a) werden erhalten, Verfahren b-1), wenn man 2-Hydroxy-3-nitrobenzoesäure oder 2-Hydroxy-3-nitrobenzoylchlorid mit einem Amin der Formel (VIII),

 $H_2$ N-A-R<sup>3</sup> (VIII)

in welcher

25

A und R<sup>3</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, vorzugsweise eines aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Kohlenwasserstoffes, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; eines halogenierten Kohlenwasserstoffes, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorbenzol,

10

15

20

25

30

ethan oder Trichlorethan; eines Ethers, wie Diethylether, Diisopropylether, Methylt-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2- Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; eines Ketons, wie Aceton, Butanon, Methyl-isobutylketon oder Cyclohexanon; eines Nitrils, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; eines Amids, wie N.N-Dimethylformamid, N.N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; eines Esters wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; eines Sulfoxids, wie Dimethylsulfoxid; oder eines Sulfons, wie Sulfolan, gegebenenfalls in Gegenwart eines Kondensationsmittel, beispielsweise eines Säurehalogenidbildners wie Phosgen, Phosphortribromid, Phosphortrichlorid, Phosphorpentachlorid, Phosphoroxychlorid oder Thionylchlorid; eines Anhydridbildners wie Chlorameisensäureethylester, Chlorameisensäuremethylester, Chlorameisensäureisopropylester, Chlorameisensäureisobutylester oder Methansulfonylchlorid; eines Carbodiimides, wie N,N'-Dicyclohexylcarbodiimid (DCC) oder eines anderen üblichen Kondensationsmittels, wie Phosphorpentoxid, Polyphosphorsäure, N,N'-Carbonyldiimidazol, 2-Ethoxy-N-ethoxycarbonyl-1,2-dihydrochinolin (EEDQ) oder Triphenylphosphin/Tetrachlorkohlenstoff und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors, vorzugsweise eines Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydrides, -hydroxides, -amids, -alkoholates, -acetates, -carbonates oder -hydrogencarbonates, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natriumethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Ammoniumcarbonat, oder eines tertiären Amines, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU), umsetzt.

Ferner wurde gefunden, daß die neuen Nitrosalicylsäureamide der Formel (IV-a) sich zur Bekämpfung von Schädlingen an Pflanzen und technischen Materialien, vorzugsweise Pilzen, Insekten und Bakterien, eignen.

Die neuen Nitrosalicylsäureamide sind durch die Formel (IV-a) allgemein definiert. Bevorzugt sind die neuen Verbindungen der Formel (IV-a), in welcher

- Z für eine Einfachbindung oder für eine Alkylenkette mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,
- für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Halogen, Cyano, Carboxy, Phenyl (welches gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy substituiert ist), C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl substituiertes Cycloalkyl oder Cycloalkenyl mit 3 bis 12 Kohlenstoffatomen;

für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden substituiertes Aryl mit 3 bis 12 Ringgliedern oder für Heterocyclyl mit 3 bis 8 Ringgliedern steht, wobei die möglichen Substituenten vorzugsweise aus der nachstehenden Aufzählung ausgewählt sind:

Halogen, Cyano, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Acylamino, N-Acyl-N-alkylamino, Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxy-carbonyl, Alkylsulfonyloxy, Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen;

15

10

20

jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Alkylen oder Dioxyalkylen mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen;

sowie jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch

Halogen, Cyano, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Acylamino, N-Acyl-N-alkylamino, Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxy-carbonyl, Alkylsulfonyloxy, Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen,

jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4

15

20

Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Alkylen oder Dioxyalkylen mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

5 Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen;

substituiertes Aryl, Aryloxy, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxy, Arylalkylthio, Aryloxyalkyl, Arylthioalkyl, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, Heterocyclylalkyl, Heterocyclylalkyloxy oder Heterocyclylalkylthio.

- Die Erfindung betrifft insbesondere die neuen Nitrosalicylsäureamide der Formel (IV-a), in welcher
  - A für eine Einfachbindung oder für Methylen, 1,1-Ethylen, 1,2-Ethylen 1,1-, 1,2-, 1,3- oder 2,2-Propylen, 1,1-, 1,2-, 1,3-, 1,4-, 2,2-, 2,3-Butylen oder 1,1-, 1,2- oder 1,3-(2-Methyl-propylen) steht,
- 15 R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy steht,
- für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Carboxy, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propyl, Methoxy-carbonyl oder Ethoxy-carbonyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl, Cyclooctyl, Cyclononyl, Cyclodecyl, Cycloundecyl, Cyclododecyl, Tetralinyl, Decalinyl, Cyclododecatrienyl, Indanyl, Norbornyl oder Adamantyl;
- oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach substituiertes Phenyl, Naphthyl, Benzyl, Phenethyl, Furyl, Benzofuranyl, Pyrrolyl, Indolyl, Thienyl, Benzothienyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Thiazolyl, Isothiazolyl, Oxadiazolyl, Thiadiazolyl, Pyridyl, Chinolyl, Pyrimidyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl, Oxiranyl, Oxetanyl, Tetrahydrofuryl, Perhydropyranyl, Pyrrolidinyl, Piperidinyl oder Morpholinyl steht, wobei die möglichen Substituenten vorzugsweise aus der nachstehenden Aufzählung ausgewählt sind:

10

15

20

25

30

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Formylamino, N-Formyl-N-methylamino, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl, oder Ethoximinoethyl,

jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Tetramethylen (Butan-1,4-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.

und/oder gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Formyl, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluormethoxy, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Formylamino, N-Formyl-N-methylamino, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl oder Ethoximinoethyl,

jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl sub-

stituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Tetramethylen (Butan-1,4-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

substituiertes Phenyl, Phenoxy, Phenylalkyl, Phenylthio, Phenoxyalkyl, Phenylthioalkyl, Phenylalkyloxy oder Phenylalkylthio, mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den jeweiligen Alkylketten.

Besonders bevorzugt sind die neuen Nitrosalicylsäureamide der Formel (IV-a), in welcher

- A für eine Einfachbindung oder für Methylen, 1,1-Ethylen, 1,2-Ethylen 1,1-, 10

  1,2-, 1,3- oder 2,2-Propylen, 1,1-, 1,2-, 1,3-, 1,4-, 2,2-, 2,3-Butylen oder 1,1-, 1,2- oder 1,3-(2-Methyl-propylen) steht,
  - R1 für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy steht,
- für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Fluor, Chlor, Brom,
  Cyano, Carboxy, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propyl,
  Methoxy-carbonyl oder Ethoxy-carbonyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl, Cyclooctyl, Cyclononyl,
  Cyclodecyl, Cycloundecyl, Cyclododecyl, Tetralinyl, Decalinyl,
  Cyclododecatrienyl, Indanyl, Norbornyl oder Adamantyl;
- für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach substituiertes Phenyl,
  Naphthyl, Benzyl, Phenethyl, Furyl, Benzofuranyl, Pyrrolyl, Indolyl,
  Thienyl, Benzothienyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Thiazolyl, Isothiazolyl, Oxadiazolyl, Thiadiazolyl, Pyridyl, Chinolyl, Pyrimidyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl,
  Oxiranyl, Oxetanyl, Tetrahydrofuryl, Perhydropyranyl, Pyrrolidinyl,
  Piperidinyl oder Morpholinyl steht, wobei die möglichen Substituenten vorzugsweise aus der nachstehenden Aufzählung ausgewählt sind:

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Formyl, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl,

Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Formylamino, N-Formyl-N-methylamino, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl oder Ethoximinoethyl.

jeweils gegebenenfalls einfach bis vie rfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Tetramethylen (Butan-1,4-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

und/oder gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Formyl, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Formylamino, N-Formyl-N-methylamino, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl oder Ethoximinoethyl,

jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Tetramethylen (Butan-1,4-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

10

5

15

20

20

25

30

substituiertes Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Benzyl, Phenylethyl, Phenylpropyl, Benzyloxy, Benzylthio, Phenoxymethyl, Phenoxyethyl, Phenylthiomethyl oder Phenylthioethyl.

Ganz besonders bevorzugt sind die neuen Nitrosalicylsäureamide der Formel (IVa), in welcher

- A für eine Einfachbindung oder für Methylen, 1,1-Ethylen, 1,2-Ethylen, 1,1-Propylen, 1,2-Propylen oder 2,2-Propylen steht,
- R<sup>1</sup> für Wasserstoff steht,
- für jeweils gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Methyl, Ethyl,
  Methoxy oder Ethoxy substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl,
  Cyclohexyl, Cycloheptyl, Cyclooctyl, Cyclononyl, Cyclodecyl, Cycloundecyl, Cyclododecyl, Tetralinyl, Decalinyl, Cyclododecatrienyl, Indanyl,
  Norbornyl oder Adamantyl;

für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach substituiertes Phenyl, Naphthyl, Furyl, Benzofuranyl, Pyrrolyl, Indolyl, Thienyl, Benzothienyl, Pyridyl, Chinolyl, Pyrimidyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl steht, wobei die möglichen Substituenten vorzugsweise aus der nachstehenden Aufzählung ausgewählt sind:

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Formylamino, N-Formyl-N-methylamino, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl oder Ethoximinoethyl,

jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Tetramethylen (Butan-1,4-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

5

und/oder gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Formyl, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Formylamino, N-Formyl-N-methylamino, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl oder Ethoximinoethyl,

15

10

jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Tetramethylen (Butan-1,4-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

20

substituiertes Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Benzyl, Phenyl-1-ethyl, Phenyl-2-ethyl, Benzyloxy, Benzylthio, Phenoxymethyl oder Phenylthiomethyl.

25

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens b-1) als Ausgangsstoffe benötigte 2-Hydroxy-3-nitrobenzoesäure oder 2-Hydroxy-3-nitrobenzoesäurechlorid sind bekannt (vergleiche z. B. J.Chem.Soc., 1953 2049, 2050 oder US-Patent 03527865).

30

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens b-1) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Amine sind durch die Formel (VIII) allgemein definiert. In dieser Formel (VIII) haben A und R<sup>3</sup> vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (IV-a) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für A und R<sup>3</sup> angegeben wurden.

10

15

20

25

30

Die Amine der Formel (VIII) sind bekannte Reagentien in der organischen Chemie.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens c) als Ausgangsstoffe benötigten O-Benzyl-nitrosalicylsäureamide der Formel (V) sind bereits weiter oben im Zusammenhang mit der Beschreibung des erfindungsgemäßen Verfahrens a-1b) beschrieben worden.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens a) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2- Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Ketone, wie Aceton, Butanon, Methyl-isobutylketon oder Cyclohexanon; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid oder Sulfone, wie Sulfolan.

Das erfindungsgemäße Verfahren a) wird gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Säureakzeptors durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydroxide, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat oder Natriumhydrogencarbonat sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Die erfindungsgemäßen Verfahren b) und c) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators durchgeführt. Als solche kommen alle Katalysatoren infrage, die auch für Hydrierungen üblicherweise verwendet werden. Beispielhaft seien

15

20

genannt: Raney-Nickel, Palladium oder Platin, gegebenenfalls auf einem Trägermaterial, wie beispielsweise Aktivkohle.

Das erfindungsgemäße Verfahren c) wird gegebenenfalls auch in Gegenwart von Wasserstoff oder gegebenenfalls in Gegenwart eines unedlen Metalls durchgeführt. Als unedle Metalle seien beispielhaft genannt: Zink, Zinn, Eisen, Aluminium oder Magnesium.

Als weitere Reaktionshilfsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren a), b) und c) kommen alle wasserentziehenden Mittel, insbesondere Essigsäureanhydrid, infrage.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahrens a), b) und c) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 180°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 0°C bis 130°C.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens a) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro Mol des Aminosalicylsäureamids der Formel (II) im allgemeinen 1 bis 2000 Mol, vorzugsweise 1 bis 800 Mol Acylierungsmittel der Formel (III) ein.

Zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren b) und c) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro Mol des Nitrosalicylsäureamides der Formel (IV), bzw. des O-Benzyl-nitrosalicylsäureamides der Formel (V) im allgemeinen 100 bis 2000 Mol, vorzugsweise 200 bis 1000 Mol Ameisensäure ein.

Die erfindungsgemäßen Verfahren a), b) und c) werden im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, unter erhöhtem oder vermindertem Druck - im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar - zu arbeiten.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen praktisch eingesetzt werden. Die Wirkstoffe sind für den Gebrauch als Pflanzenschutzmittel, insbesondere als Fungizide geeignet.

Fungizide Mittel im Pflanzenschutz werden eingesetzt zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes, Deuteromycetes.

Bakterizide Mittel werden im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae eingesetzt.

Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

- Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise Xanthomonas campestris pv. oryzae;
  Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise Pseudomonas syringae pv. lachrymans;
  Erwinia-Arten, wie beispielsweise Erwinia amylovora;
  Pythium-Arten, wie beispielsweise Pythium ultimum;
  Phytophthora-Arten, wie beispielsweise Phytophthora infestans;
- Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise Pseudoperonospora humuli oder Pseudoperonospora cubensis;
  Plasmopara-Arten, wie beispielsweise Plasmopara viticola;
  Bremia-Arten, wie beispielsweise Bremia lactucae;
  Peronospora-Arten, wie beispielsweise Peronospora pisi oder P. brassicae;
- 20 Erysiphe-Arten, wie beispielsweise Erysiphe graminis;
  Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise Sphaerotheca fuliginea;
  Podosphaera-Arten, wie beispielsweise Podosphaera leucotricha;
  Venturia-Arten, wie beispielsweise Venturia inaequalis;
  Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise Pyrenophora teres oder P. graminea
- 25 (Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);
  Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise Cochliobolus sativus
  (Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);
  Uromyces-Arten, wie beispielsweise Uromyces appendiculatus;
  Puccinia-Arten, wie beispielsweise Puccinia recondita;
- Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise Sclerotinia sclerotiorum;
  Tilletia-Arten, wie beispielsweise Tilletia caries;
  Ustilago-Arten, wie beispielsweise Ustilago nuda oder Ustilago avenae;
  Pellicularia-Arten, wie beispielsweise Pellicularia sasakii;
  Pyricularia-Arten, wie beispielsweise Pyricularia oryzae;

20

25

30

Fusarium-Arten, wie beispielsweise Fusarium culmorum;
Botrytis-Arten, wie beispielsweise Botrytis cinerea;
Septoria-Arten, wie beispielsweise Septoria nodorum;
Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise Leptosphaeria nodorum;
Cercospora-Arten, wie beispielsweise Cercospora capaciers;

Cercospora-Arten, wie beispielsweise Cercospora canescens;
Alternaria-Arten, wie beispielsweise Alternaria brassicae;
Pseudocercosporella-Arten, wie beispielsweise Pseudocercosporella herpotrichoides

Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut, und des Bodens.

Dabei werden die erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von Krankheiten im Wein-, Obst- und Gemüseanbau, wie beispielsweise gegen Sphaerotheca- und Venturia-Arten, zur Bekämpfung von Getreidekrankheiten, wie beispielsweise gegen Pseudocercosporella-Arten, oder zur Bekämpfung von Reiskrankheiten, wie beispielsweise gegen Pyricularia oryzae, eingesetzt. Mit gutem Erfolg werden auch weitere Getreidekrankheiten, wie Septoria-, Cochliobolus- und Pyrenophora-Arten, bekämpft. Mit gutem Erfolg werden auch weitere Krankheiten im Wein-, Obst- und Gemüsebau, wie Phytophthora, Plasmopara, Podosphaera und Botrytis bekämpft.

Die Wirkstoffe werden in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen übergeführt, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkylnaphthaline, chlorierte

10

15

20

25

30

Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengel. Als Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylarylpolyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

30

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen in Frage:

### Fungizide:

Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-Kalium, Andoprim, Anilazin, Azaconazol, Azoxystrobin,

Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutyl, Bialaphos, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticdiin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Buthiobat,

Calciumpolysulfid, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Carvon, Chinomethionat(Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozylacon, Cufraneb, Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram,

Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenoconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Di

20 nazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrithione, Ditalimfos, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Drazoxolon,

Ediphenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etridiazol,

Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenitropan, Fen-piclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fentinhydroxyd, Ferbam,

Ferimzon, Fluazinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, Flusulfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Alminium, Fosetyl-Natrium, Fthalid, Fuberidazol, Furalaxyl, Furametpyr, Furcarbonil, Furconazol, Furconazol-cis, Furmecyclox, Guazatin.

Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol,

Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealbesilate, Iminoctadinetriacetate, Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfosufen(IBP), Iprodione, Irumamycin, Isoprothiolan, Isovaledione,

Kasugamycin, Kresoxim-methyl, Kupfer-Zubereitungen, wie: Kupferhydroxid, Kupfernaphthenat, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Kupferoxid, Oxin-Kupfer und Boerdeaux-Mischung,

Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanipyrim, Mepronil, Metalaxyl,

- Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfovax, Mildiomycin, Myclobutanil, Myclozolin,
  - Nickel-dimethyldithiocarbamat, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol,
  - Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolinicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthiin,

Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Pimaricin,

- Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazole, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb, Propanosine-Natrium, Propiconazol, Propineb, Pyrazophos, Pyrifenox, Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyfur,
  - Quinconazol, Quintozcen(PCNB),

Schwefel und Schwefel-Zubereitungen,

- Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnhazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol, Thicyofen, Thifluzamide, Tthiophanate-methyl, Thiram, Tioxymid, Tolclofosmethyl, Tolylfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutanil, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol, Tridemorph, Triflumizol, Triforin, Triticonazol, Uniconazol.
- 20 Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol,

Zarilamid, Zineb, Ziram sowie

Dagger G,

OK-8705,

OK-8801,

- 25 2',6'-Dibrom-2-methyl-4'-trifluormethoxy-4'-trifluor-methyl-1,3-thiazol-5-carboxanilid,
  - 2,6-Dichlor-N-(4-trifluormethylbenzyl)-benzamid,
  - 2-Aminobutan.
  - 2-Phenylphenol(OPP),
- 30 8-Hydroxychinolinsulfat,
  - cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol,
  - (5RS,6RS)-6-Hydroxy-2,2,7,7-tetramethyl-5-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-octanon,
  - $\alpha$ -(2,4-Dichlorphenyl)- $\beta$ -methoxy- $\alpha$ -methyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
  - $\alpha$ -(1,1-Dimethylethyl)- $\beta$ -(2-phenoxyethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
- 35 l-[1-[2-[(2,4-Dichlorphenyl)methoxy]phenyl]ethenyl]-1H-imidazol, bis-(1-Methylethyl)-3-methyl-4-[(3-methylbenzoyl)oxy]-2,5-thiophendicarboxylat, 2,6-Dichlor-N-[[4-(trifluormethyl)phenyl]methyl]-benzamid.

- (E)-α-(Methoxyimino)-N-methyl-2-phenoxy-phenylacetamid,
- 9H-Xanthen-9-carbonsäure-2-[(phenylamino)-carbonyl]-hydrazid,
- O-Methyl-S-phenyl-phenylpropylphosphoramidothioate.
- N-(5-Chlor-2-methylphenyl)-2-methoxy-N-(2-.oxo-3-oxazolidinyl)-acetamid,
- 5 1-(2,4-Dichlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)ethanon-O-(phenylmethyl)-oxim, N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-thienyl)-acetamid, cis-4-[3-[4-(1,1-Dimethylpropyl)-phenyl-2-methylpropyl]-2,6-dimethyl-morpholinhydrochlorid,
  - 1-(3,5-Dichlorphenyl)-3-(2-propenyl)-2,5-pyrrolidindion,
- 10 1-Methyl-5-nonyl-2-(phenylmethyl)-3-pyrrolidinol,
  - 1-[[2-(4-Chlorphenyl)-3-phenyloxiranyl]-methyl]-1H-1,2,4-triazol,
  - Methantetrathiol, -Natriumsalz,
  - 2-(2,3,3-Triiod-2-propenyl)-2H-tetrazol,
  - N-(2,3-Dichlor-4-hydroxyphenyl)-1-methyl-cyclohexancarboxamid.
- N-[3-Chlor-4,5-bis(2-propinyloxy)-phenyl]-N'-methoxy-methanimidamid,  $\alpha$ -(5-Methyl-1,3-dioxan-5-yl)- $\beta$ -[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methylen]-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
  - 2,2-Dichlor-N-[1-(4-chlorphenyl)ethyl]-1-ethyl-3-methyl-cyclopropancarboxamid, 1-(2-Methyl-1-naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion,
- N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-furanyl)-acetamid, 3,4-Dichlor-1-[4-(difluormethoxy)-phenyl]-1H-pyrrol-2,5-dion, 8-(1,1-Dimethylethyl)-N-ethyl-N-propyl-1,4-dioxaspiro[4.5]decan-2-methanamin,
  - N-[2,2,2-Trichlor-1-[(chloracetyl)-amino]-ethyl]-benzamid,
  - N-Formyl-N-hydroxy-DL-alanin, -Mono-Natriumsalz,
- 4-Chlor-2-cyan-N,N-dimethyl-5-(4-methylphenyl)-1H-imidazol-1-sulfonamid, N-(4-Cyclohexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
  - 4-Methyl-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-onm,2-Chlor-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(isothiocyanatomethyl)-acetamid,
  - Ethyl-[(4-chlorphenyl)-azo]-cyanoacetat,
- 30 3,5-Dichlor-N-[cyan[(1-methyl-2-propynyl)oxy]methyl]-benzamid,
  - N-(4-Hexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
  - N-(2-Chlor-4-nitrophenyl)-4-methyl-3-nitro-benzolsulfonamid,
  - N-(6-Methoxy)-3-pyridinyl)-cyclopropancarboxamid,
  - Methyl-N-(chloracetyl)-N-(2,6-dimethylphenyl)-DL-alaninat,
- 35 3-[2-(4-Chlorphenyl)-5-ethoxy-3-isoxazolidinyl]-pyridin,
  - S-Methyl-1,2,3-benzothiadiazol-7-carbothioat,
  - 2-[(1-Methylethyl)sulfonyl]-5-(trichlormethyl)-1,3,4-thiadiazol,

spiro[2H]-1-Benzopyran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-on,

[2-Methyl-1-[[[1-(4-methylphenyl)ethyl]amino]carbonyl]-propyl]-carbaminsäure-1-methylethylester,

Methyl-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(5-isoxazolylcarbonyl)-DL-alaninat,

5 Kaliumhydrogencarbonat,

Pflanzen behandelt.

30

- 1-[[2-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-dioxolan-2-yl]-methyl]-1H-imidazol,
- 1-[(Diiodmethyl)-sulfonyl]-4-methyl-benzol,
- 2-Brom-2-(brommethyl)-pentandinitril,
- $2-[[6-Deoxy-4-O-(4-O-methyl-\beta-D-glycopyranosyl)-\alpha-D-glucopyranosyl]-amino]-4-\\$
- methoxy-1H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-5-carbonitril,
  - Methyl-1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat,
  - 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid,
  - O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat,
  - $\alpha$ -(2,4-Dichlorphenyl)- $\beta$ -fluor- $\beta$ -propyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
- 15 3-(1,1-Dimethylpropyl-1-oxo-1H-inden-2-carbonitril,
  - 2,6-Dichlor-5-(methylthio)-4-pyrimidinyl-thiocyanat.

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren ist möglich.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe werden als solche, in Form ihren handelsüblichen Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritzpulver, Pasten, lösliche Pulver,
Stäubemittel und Granulate angewendet. Die Anwendung geschieht in üblicher
Weise, z.B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen, Verstreuen, Verschäumen,
Bestreichen usw.. Gegebenenfalls werden die Wirkstoffe nach dem Ultra-LowVolume-Verfahren ausgebracht oder die Wirkstoffzubereitung oder der Wirkstoff
selbst wird in den Boden injiziert. Gegebenenfalls wird auch das Saatgut der

Bei der Behandlung von Pflanzenteilen können die Wirkstoffkonzentrationen in den Anwendungsformen in einem größeren Bereich variiert werden: Sie liegen im allgemeinen zwischen 1 und 0,0001 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,5 und 0,001 Gew.-%.

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 50 g je Kilogramm Saatgut, vorzugsweise 0,01 bis 10 g benötigt.

Bei der Behandlung des Bodens sind Wirkstoffkonzentrationen von 0,00001 bis 0,1 Gew.-%, vorzugsweise von 0,0001 bis 0,02 Gew.-% am Wirkungsort erforderlich.

Die Wirkstoffe eignen sich bei guter Pflanzenverträglichkeit und günstiger Warmblütertoxizität auch zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere Insekten, Spinnentieren und Nematoden, die in der Landwirtschaft, in Forsten, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor vorkommen. Sie können vorzugsweise als Pflanzenschutzmittel eingesetzt werden. Sie sind gegen normal sensible und resistente Arten sowie gegen alle oder einzelne Entwicklungsstadien wirksam. Zu den oben erwähnten Schädlingen gehören:

Aus der Ordnung der Isopoda z.B. Oniscus asellus, Armadillidium vulgare, Porcellio scaber.

Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. Blaniulus guttulatus.

Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. Geophilus carpophagus, Scutigera spec.

15 Aus der Ordnung der Symphyla z.B. Scutigerella immaculata.

Aus der Ordnung der Thysanura z.B. Lepisma saccharina.

Aus der Ordnung der Collembola z.B. Onychiurus armatus.

Aus der Ordnung der Orthoptera z.B. Blatta orientalis, Periplaneta americana, Leucophaea maderae, Blattella germanica, Acheta domesticus, Gryllotalpa spp.,

Locusta migratoria migratorioides, Melanoplus differentialis, Schistocerca gregaria.

Aus der Ordnung der Dermaptera z.B. Forficula auricularia.

Aus der Ordnung der Isoptera z.B. Reticulitermes spp..

Aus der Ordnung der Anoplura z.B. Pediculus humanus corporis, Haematopinus spp., Linognathus spp.

Aus der Ordnung der Mallophaga z.B. Trichodectes spp., Damalinea spp.

Aus der Ordnung der Thysanoptera z.B. Hercinothrips femoralis, Thrips tabaci.

Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. Eurygaster spp., Dysdercus intermedius,

Piesma quadrata, Cimex lectularius, Rhodnius prolixus, Triatoma spp.

Aus der Ordnung der Homoptera z.B. Aleurodes brassicae, Bemisia tabaci,
Trialeurodes vaporariorum, Aphis gossypii, Brevicoryne brassicae, Cryptomyzus
ribis, Aphis fabae, Aphis pomi, Eriosoma lanigerum, Hyalopterus arundinis,
Phylloxera vastatrix, Pemphigus spp., Macrosiphum avenae, Myzus spp., Phorodon
humuli, Rhopalosiphum padi, Empoasca spp., Euscelis bilobatus, Nephotettix

10

15

cincticeps, Lecanium corni, Saissetia oleae, Laodelphax striatellus, Nilaparvata lugens, Aonidiella aurantii, Aspidiotus hederae, Pseudococcus spp., Psylla spp.

Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. Pectinophora gossypiella, Bupalus piniarius, Cheimatobia brumata, Lithocolletis blancardella, Hyponomeuta padella, Plutella maculipennis, Malacosoma neustria, Euproctis chrysorrhoea, Lymantria spp., Bucculatrix thurberiella, Phyllocnistis citrella, Agrotis spp., Euxoa spp., Feltia spp., Earias insulana, Heliothis spp., Spodoptera exigua, Mamestra brassicae, Panolis flammea, Spodoptera litura, Spodoptera spp., Trichoplusia ni, Carpocapsa pomonella, Pieris spp., Chilo spp., Pyrausta nubilalis, Ephestia kuehniella, Galleria mellonella, Tineola bisselliella, Tinea pellionella, Hofmannophila pseudospretella, Cacoecia podana, Capua reticulana, Choristoneura fumiferana, Clysia ambiguella, Homona magnanima, Tortrix viridana.

Aus der Ordnung der Coleoptera z.B. Anobium punctatum, Rhizopertha dominica, Bruchidius obtectus, Acanthoscelides obtectus, Hylotrupes bajulus, Agelastica alni,

- Leptinotarsa decemlineata, Phaedon cochleariae, Diabrotica spp., Psylliodes chrysocephala, Epilachna varivestis, Atomaria spp., Oryzaephilus surinamensis, Anthonomus spp., Sitophilus spp., Otiorrhynchus sulcatus, Cosmopolites sordidus, Ceuthorrhynchus assimilis, Hypera postica, Dermestes spp., Trogoderma spp., Anthrenus spp., Attagenus spp., Lyctus spp., Meligethes aeneus, Ptinus spp.,
- Niptus hololeucus, Gibbium psylloides, Tribolium spp., Tenebrio molitor, Agriotes spp., Conoderus spp., Melolontha melolontha, Amphimallon solstitialis, Costelytra zealandica.
  - Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp.
- Aus der Ordnung der Diptera z.B. Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Drosophila melanogaster, Musca spp., Fannia spp., Calliphora erythrocephala, Lucilia spp., Chrysomyia spp., Cuterebra spp., Gastrophilus spp., Hyppobosca spp., Stomoxys spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Tabanus spp., Tannia spp., Bibio hortulanus, Oscinella frit, Phorbia spp., Pegomyia hyoscyami, Ceratitis capitata, Dacus oleae Tipula paludosa
- Dacus oleae, Tipula paludosa.

  Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. Xenopsylla cheopis, Ceratophyllus spp..

  Aus der Ordnung der Arachnida z.B. Scorpio maurus, Latrodectus mactans.

  Aus der Ordnung der Acarina z.B. Acarus siro, Argas spp., Ornithodoros spp.,

  Dermanyssus gallinae, Eriophyes ribis, Phyllocoptruta oleivora, Boophilus spp.,
- Rhipicephalus spp., Amblyomma spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Sarcoptes spp., Tarsonemus spp., Bryobia praetiosa, Panonychus spp., Tetranychus spp..

Zu den pflanzenparasitären Nematoden gehören z.B. Pratylenchus spp., Radopholus similis, Ditylenchus dipsaci, Tylenchulus semipenetrans, Heterodera spp., Globodera spp., Meloidogyne spp., Aphelenchoides spp., Longidorus spp., Xiphinema spp., Trichodorus spp..

- Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) zeichnen sich insbesondere durch ihre Wirkung gegen die Larven des Meerrettichblattkäfers (Phaedon cochleariae), die Raupen der Kohlschabe (Plutella maculipennis), die Raupen des Eulenfalters (spodoptera frugiperda), sowie gegen die grüne Reiszikade (Nephotettix cincticeps) aus.
- Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.
- Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln.
- Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.
- 30 Als feste Trägerstoffe kommen in Frage:

10

15

20

25

30

z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengeln; als Emulgier- und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylaryl-polyglykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Einweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Der erfindungsgemäße Wirkstoff kann in seinen handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit anderen Wirkstoffen, wie Insektiziden, Lockstoffen, Sterilantien, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden, Fungiziden, wachstumsregulierenden Stoffen oder Herbiziden vorliegen. Zu den Insektiziden zählen beispielsweise Phosphorsäureester, Carbamate, Carbonsäureester, chlorierte Kohlenwasserstoffe, Phenylharnstoffe, durch Mikroorganismen hergestellte Stoffe u.a.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können ferner in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen

15

in Mischung mit Synergisten vorliegen. Synergisten sind Verbindungen, durch die die Wirkung der Wirkstoffe gesteigert wird, ohne daß der zugesetzte Synergist selbst aktiv wirksam sein muß.

Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen kann in weiten Bereichen variieren. Die Wirkstoffkonzentration der Anwendungsformen kann von 0,0000001 bis zu 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,0001 und 1 Gew.-% liegen.

Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepaßten üblichen Weise.

Bei der Anwendung gegen Hygiene- und Vorratsschädlinge zeichnet sich der Wirkstoff durch eine hervorragende Residualwirkung auf Holz und Ton sowie durch eine gute Alkalistabilität auf gekälkten Unterlagen aus.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe wirken nicht nur gegen Pflanzen-, Hygieneund Vorratsschädlinge, sondern auch auf dem veterinärmedizinischen Sektor gegen tierische Parasiten (Ektoparasiten) wie Schildzecken, Lederzecken, Räudemilben, Laufmilben, Fliegen (stechend und leckend), parasitierende Fliegenlarven, Läuse, Haarlinge, Federlinge und Flöhe. Zu diesen Parasiten gehören:

Aus der Ordnung der Anoplurida z.B. Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Phtirus spp., Solenopotes spp..

Aus der Ordnung der Mallophagida und den Unterordnungen Amblycerina sowie Ischnocerina z.B. Trimenopon spp., Menopon spp., Trinoton spp., Bovicola spp., Werneckiella spp., Lepikentron spp., Damalina spp., Trichodectes spp., Felicola spp..

Aus der Ordnung Diptera und den Unterordnungen Nematocerina sowie Brachycerina z.B. Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Simulium spp., Eusimulium spp., Phlebotomus spp., Lutzomyia spp., Culicoides spp., Chrysops spp., Hybomitra spp., Atylotus spp., Tabanus spp., Haematopota spp., Philipomyia spp., Braula spp., Musca spp., Hydrotaea spp., Stomoxys spp., Haematobia spp., Morellia spp., Fannia spp., Glossina spp., Calliphora spp., Lucilia spp., Chryso-

myia spp., Wohlfahrtia spp., Sarcophaga spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Gasterophilus spp., Hippobosca spp., Lipoptena spp., Melophagus spp..

Aus der Ordnung der Siphonapterida z.B. Pulex spp., Ctenocephalides spp., Xenopsylla spp., Ceratophyllus spp..

Aus der Ordnung der Heteropterida z.B. Cimex spp., Triatoma spp., Rhodnius spp., Panstrongylus spp..

Aus der Ordnung der Blattarida z.B. Blatta orientalis, Periplaneta americana, Blattela germanica, Supella spp..

Aus der Unterklasse der Acaria (Acarida) und den Ordnungen der Meta- sowie

Mesostigmata z.B. Argas spp., Ornithodorus spp., Otobius spp., Ixodes spp.,

Amblyomma spp., Boophilus spp., Dermacentor spp., Haemophysalis spp.,

Hyalomma spp., Rhipicephalus spp., Dermanyssus spp., Raillietia spp.,

Pneumonyssus spp., Sternostoma spp., Varroa spp..

Aus der Ordnung der Actinedida (Prostigmata) und Acaridida (Astigmata) z.B.

Acarapis spp., Cheyletiella spp., Ornithocheyletia spp., Myobia spp., Psorergates spp., Demodex spp., Trombicula spp., Listrophorus spp., Acarus spp., Tyrophagus spp., Caloglyphus spp., Hypodectes spp., Pterolichus spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Cytodites spp., Laminosioptes spp..

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe der Formel (I) eignen sich auch zur Bekämpfung von Arthropoden, die landwirtschaftliche Nutztiere, wie z.B. Rinder, Schafe, Ziegen, Pferde, Schweine, Esel, Kamele, Büffel, Kaninchen, Hühner, Puten, Enten, Gänse, Bienen, sonstige Haustiere wie z.B. Hunde, Katzen, Stubenvögel, Aquarienfische sowie sogenannte Versuchstiere, wie z.B. Hamster, Meerschweinchen, Ratten und Mäuse befallen. Durch die Bekämpfung dieser Arthropoden sollen Todesfälle und Leistungsminderungen (bei Fleisch, Milch, Wolle, Häuten, Eiern, Honig usw.) vermindert werden, so daß durch den Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe eine wirtschaftlichere und einfachere Tierhaltung möglich ist.

Die Anwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geschieht im Veterinärsektor in bekannter Weise durch enterale Verabreichung in Form von beispielsweise Tab-

letten, Kapseln, Tränken, Drenchen, Granulaten, Pasten, Boli, des feed-through-Verfahrens, von Zäpfchen, durch parenterale Verabreichung, wie zum Beispiel durch Injektionen (intramuskulär, subcutan, intravenös, intraperitonal u.a.), Implantate, durch nasale Applikation, durch dermale Anwendung in Form beispielsweise des Tauchens oder Badens (Dippen), Sprühens (Spray), Aufgießens (Pour-on und Spot-on), des Waschens, des Einpuderns sowie mit Hilfe von wirkstoffhaltigen Formkörpern, wie Halsbändern, Ohrmarken, Schwanzmarken, Gliedmaßenbändern, Halftern, Markierungsvorrichtungen usw.

Bei der Anwendung für Vieh, Geflügel, Haustiere etc. kann man die Wirkstoffe der Formel (I) als Formulierungen (beispielsweise Pulver, Emulsionen, fließfähige Mittel), die die Wirkstoffe in einer Menge von 1 bis 80 Gew.-% enthalten, direkt oder nach 100 bis 10 000-facher Verdünnung anwenden oder sie als chemisches Bad verwenden.

Außerdem wurde gefunden, daß die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel

(I) eine hohe insektizide Wirkung gegen Insekten zeigen, die technische Materialien zerstören.

Beispielhaft und vorzugsweise - ohne jedoch zu limitieren - seien die folgenden Insekten genannt:

Käfer wie

Hylotrupes bajulus, Chlorophorus pilosis, Anobium punctatum, Xestobium rufovillosum, Ptilinus pecticornis, Dendrobium pertinex, Ernobius mollis, Priobium carpini, Lyctus brunneus, Lyctus africanus, Lyctus planicollis, Lyctus linearis, Lyctus pubescens, Trogoxylon aequale, Minthes rugicollis; Xyleborus spec. Tryptodendron spec. Apate monachus, Bostrychus capucins, Heterobostrychus brunneus, Sinoxylon spec. Dinoderus minutus

Hautflügler wie

Sirex juvencus, Urocerus gigas, Urocerus gigas taignus, Urocerus augur

Termiten wie

15

20

25

Kalotermes flavicollis, Cryptotermes brevis, Heterotermes indicola, Reticulitermes flavipes, Reticulitermes santonensis, Reticulitermes lucifugus, Mastotermes darwiniensis, Zootermopsis nevadensis, Coptotermes formosanus.

Borstenschwänze, wie Lepisma saccarina.

Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nicht-lebende Materialien zu verstehen, wie vorzugsweise Kunststoffe, Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz und Holzverarbeitungsprodukte und Anstrichmittel.

Ganz besonders bevorzugt handelt es sich bei dem vor Insektenbefall zu schützenden Material um Holz und Holzverarbeitungsprodukte.

Unter Holz und Holzverarbeitungsprodukten, welche durch das erfindungsgemäße Mittel bzw. dieses enthaltende Mischungen geschützt werden kann, ist beispielhaft zu verstehen: Bauholz, Holzbalken, Eisenbahnschwellen, Brückenteile, Bootsstege, Holzfahrzeuge, Kisten, Paletten, Container, Telefonmasten, Holzverkleidungen, Holzfenster und- türen, Sperrholz, Spanplatten, Tischlerarbeiten oder Holzprodukte, die ganz allgemein beim Hausbau oder in der Bautischlerei Verwendung finden.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form von Konzentraten oder allgemein üblichen Formulierungen wie Pulver, Granulate, Lösungen, Suspensionen, Emulsionen oder Pasten angewendet werden.

Die genannten Formulierungen können in an sich bekannter Weise hergestellt werden, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit mindestens einem Lösungsbzw. Verdünnungsmittel, Emulgator, Dispergier- und/oder Binde- oder Fixiermittels, Wasser-Repellent, gegebenenfalls Sikkative und UV-Stabilisatoren und gegebenenfalls Farbstoffen und Pigmenten sowie weiteren Verarbeitungshilfsmitteln.

Die zum Schutz von Holz und Holzwerkstoffen verwendeten insektiziden Mittel oder Konzentrate enthalten den erfindungsgemäßen Wirkstoff in einer Konzentration von 0,0001 bis 95 Gew.-%, insbesondere 0,001 bis 60 Gew.-%.

10

15

20

25

30

Die Menge der eingesetzten Mittel bzw. Konzentrate ist von der Art und dem Vorkommen der Insekten und von dem Medium abhängig. Die optimale Einsatzmenge kann bei der Anwendung jeweils durch Testreihen ermittelt werden. Im allgemeinen ist es jedoch ausreichend 0,0001 bis 20 Gew.-%, vorzugsweise 0,001 bis 10 Gew.-%, des Wirkstoffs, bezogen auf das zu schützende Material, einzusetzen.

Als Lösungs- und/oder Verdünnungsmittel dient ein organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder ein öliges oder ölartiges schwer flüchtiges organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder ein polares organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder Wasser und gegebenenfalls einen Emulgator und/oder Netzmittel.

Als organisch-chemische Lösungsmittel werden vorzugsweise ölige oder ölartige Lösungsmittel mit einer Verdunstungszahl über 35 und einem Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, eingesetzt. Als derartige schwerflüchtige, wasserunlösliche, ölige und ölartige Lösungsmittel werden entsprechende Mineralöle oder deren Aromatenfraktionen oder mineralölhaltige Lösungsmittelgemische, vorzugsweise Testbenzin, Petroleum und/oder Alkylbenzol verwendet.

Vorteilhaft gelangen Mineralöle mit einem Siedebereich von 170 bis 220°C, Testbenzin mit einem Siedebereich von 170 bis 220°C, Spindelöl mit einem Siedebereich von 250 bis 350°C, Petroleum bzw. Aromaten vom Siedebereich von 160 bis 280°C, Terpentinöl und dgl. zum Einsatz.

In einer bevorzugten Ausführungsform werden flüssige aliphatische Kohlenwasserstoffe mit einem Siedebereich von 180 bis 210°C oder hochsiedende Gemische von aromatischen und aliphatischen Kohlenwasserstoffen mit einem Siedebereich von 180 bis 220°C und/oder Spindeöl und/oder Monochlornaphthalin, vorzugsweise  $\alpha$ -Monochlornaphthalin, verwendet.

Die organischen schwerflüchtigen öligen oder ölartigen Lösungsmittel mit einer Verdunstungszahl über 35 und einem Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, können teilweise durch leicht oder mittelflüchtige organisch-chemische Lösungsmittel ersetzt werden, mit der Maßgabe, daß das Lösungsmittelgemisch ebenfalls eine Verdunstungszahl über 35 und einen Flammpunkt oberhalb

15

20

25

30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, aufweist und daß das Insektizid-Fungizid--Gemisch in diesem Lösungsmittelgemisch löslich oder emulgierbar ist.

Nach einer bevorzugten Ausführungsform wird ein Teil des organisch-chemischen Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisches oder ein aliphatisches polares organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch ersetzt. Vorzugsweise gelangen Hydroxyl- und/oder Ester- und/oder Ethergruppen enthaltende aliphatische organisch-chemische Lösungsmittel wie beispielsweise Glycolether, Ester oder dgl. zur Anwendung.

Als organisch-chemische Bindemittel werden im Rahmen der vorliegenden Er-10 findung die an sich bekannten wasserverdünnbaren und/oder in den eingesetzten organisch-chemischen Lösungsmitteln löslichen oder dispergier- bzw. emulgierbaren Kunstharze und/oder bindende trocknende Öle, insbesondere Bindemittel bestehend aus oder enthaltend ein Acrylatharz, ein Vinylharz, z.B. Polyvinylacetat, Polyesterharz, Polykondensations- oder Polyadditionsharz, Polyurethanharz, Alkydharz bzw. modifiziertes Alkydharz, Phenolharz, Kohlenwasserstoffharz wie Inden-Cumaronharz, Siliconharz, trocknende pflanzliche und/oder trocknende Öle und/oder physikalisch trocknende Bindemittel auf der Basis eines Natur- und/oder Kunstharzes verwendet.

Das als Bindemittel verwendete Kunstharz kann in Form einer Emulsion, Dispersion oder Lösung, eingesetzt werden. Als Bindemittel können auch Bitumen oder bituminöse Substanzen bis zu 10 Gew.-%, verwendet werden. Zusätzlich können an sich bekannte Farbstoffe, Pigmente, wasserabweisende Mittel, Geruchskorrigentien und Inhibitoren bzw. Korrosionsschutzmittel und dgl. eingesetzt werden.

Bevorzugt ist gemäß der Erfindung als organisch-chemische Bindemittel mindestens ein Alkydharz bzw. modifiziertes Alkydharz und/oder ein trocknendes pflanzliches Öl im Mittel oder im Konzentrat enthalten. Bevorzugt werden gemäß der Erfindung Alkydharze mit einem Ölgehalt von mehr als 45 Gew.-%, vorzugsweise 50 bis 68 Gew.-%, verwendet.

Das erwähnte Bindemittel kann ganz oder teilweise durch ein Fixierungs-30 mittel(gemisch) oder ein Weichmacher(gemisch) ersetzt werden. Diese Zusätze sollen einer Verflüchtigung der Wirkstoffe sowie einer Kristallisation bzw. Aus-

fällem vorbeugen. Vorzugsweise ersetzen sie 0,01 bis 30 % des Bindemittels (bezogen auf 100 % des eingesetzten Bindemittels).

Die Weichmacher stammen aus den chemischen Klassen der Phthalsäureester wie Dibutyl-, Dioctyl- oder Benzylbutylphthalat, Phosphorsäureester wie Tributylphosphat, Adipinsäureester wie Di-(2-ethylhexyl)-adipat, Stearate wie Butylstearat oder Amylstearat, Oleate wie Butyloleat, Glycerinether oder höhermolekulare Glykolether, Glycerinester sowie p-Toluolsulfonsäureester.

Fixierungsmittel basieren chemisch auf Polyvinylalkylethern wie z.B. Polyvinylmethylether oder Ketonen wie Benzophenon, Ethylenbenzophenon.

Als Lösungs- bzw. Verdünnungsmittel kommt insbesondere auch Wasser in Frage, gegebenenfalls in Mischung mit einem oder mehreren der oben genannten organisch-chemischen Lösungs- bzw. Verdünnungsmittel, Emulgatoren und Dispergatoren.

Ein besonders effektiver Holzschutz wird durch großtechnische Imprägnierverfahren, z.B. Vakuum, Doppelvakuum oder Druckverfahren, erzielt.

Die anwendungsfertigen Mittel können gegebenenfalls noch weitere Insektizide und gegebenenfalls noch ein oder mehrere Fungizide enthalten.

Als zusätzliche Zumischpartner kommen vorzugsweise die in der Wo 94/29 268 genannten Insektizide und Fungizide in Frage. Die in diesem Dokument genannten Verbindungen sind ausdrücklicher Bestandteil der vorliegenden Anmeldung.

Als ganz besonders bevorzugte Zumischpartner können Insektizide, wie Chlorpyriphos, Phoxim, Silafluofin, Alphamethrin, Cyfluthrin, Cypermethrin, Deltamethrin, Permethrin, Imidacloprid, NI-25, Flufenoxuron, Hexaflumuron und Triflumuron,

sowie Fungizide wie Epoxyconazole, Hexaconazole, Azaconazole, Propiconazole, Tebuconazole, Cyproconazole, Metconazole, Imazalil, Dichlorfluanid, Tolylfluanid, 3-Iod-2-propinyl-butylcarbamat, N-Octyl-isothiazolin-3-on und 4,5-Dichlor-N-octylisothiazolin-3-on, sein.

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gehen aus den nachfolgenden Beispielen hervor.

### Herstellungsbeispiele

#### Beispiel 1:

5

10

### Verfahren a)

1,67 g (0,005 Mol) 3-(Amino)-2-hydroxy-N-{4-[4-(methyl)-phenoxy]-phenyl}-benzamid werden in 100 ml Ameisensäure 24 Stunden unter Rückfluß zum Sieden erhitzt. Das Lösungsmittel wird bei vermindertem Druck vollständig abdestilliert. Man erhält 0,72 g (40 % der Theorie) 3-(Formylamino)-2-hydroxy-N-{4-[4-(-methyl)-phenoxy]-phenyl}-benzamid als Öl.  $^{1}$ H-NMR:(CDCl<sub>3</sub>/TMS):  $\delta = 6,80$  - 7,85 (m, 11H) ppm

### Herstellung der Ausgangsverbindung

### Beispiel (II-1):

OH OH CH<sub>3</sub>

15

#### Verfahren a-1a)

Eine Lösung von 1,3 g (0,0036 Mol) 3-Nitro-2-hydroxy-N-[4-(4-methylphenoxy)-phenyl]-benzamid in 8 ml Methanol wird mit 0,1 g Raney-Nickel versetzt und bei

20°C bei einem Druck von 3 bis 9 bar mit Wasserstoff in einem Autoklaven hydriert. Ungelöste Bestandteile der Mischung werden abfiltriert und das Filtrat bis zur Trockne bei vermindertem Druck eingeengt. Man erhält 0,67 g (56 % der Theorie) 3-Amino-2-hydroxy-N-[4-(4-methylphenoxy)-phenyl]-benzamid.

<sup>1</sup>H-NMR:(CDCl<sub>3</sub>/TMS):  $\delta = 6.73 - 7.99$  (m, 11H) ppm

### Beispiel 2:

### Verfahren b)

3 g (0,0099 Mol) 3-Nitro-2-hydroxy-N-(4-phenylphenyl)-benzoesäureamid werden mit 0,4 g 10% Palladium auf Kohle und 10 ml Wasser versetzt. Anschließend tropft man 19 ml Ameisensäure zu und erwärmt das Gemisch 2 Stunden auf 110°C. Nach dem Abkühlen wird der Katalysator abgesaugt und der Rückstand mit Wasser nachgewaschen. Das Filtrat wird mit Dichlormethan extrahiert, die organische Phase abgetrennt, über Natriumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel bei vermindertem Druck abdestilliert. Man erhält 1,4 g (48 % der Theorie) 3-Formamido-2-hydroxy-N-(4-phenylphenyl)-benzoesäureamid vom Schmelzpunkt 190°C.

### Herstellung der Ausgangsverbindung

### Beispiel IVa-1

### Verfahren b-1)

15 g (0,08 Mol) 3-Nitrosalicylsäure, 13,8 g (0,08 Mol) 4-Aminobiphenyl und 18,5 g (0,08 Mol) Bicyclohexylcarbodiimid werden in 400 ml Pyridin vorgelegt und Stunden unter rühren auf 90°C erhitzt. Nach Abkühlen, Filtrieren und Einengen des Gemisches wird mit 200 ml 10 %iger Salzsäure versetzt und mit 200 ml Dichlormethan extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden über Natriumsulfat getrocknet und im Vakuum vom Lösungsmittel befreit. Der Rückstand wird aus Toluol umkristallisiert.

Man erhält 16 g (60 % der Theorie) 3-Nitro-2-hydroxy-N-(4-phenyl)-benzoesäureamid als gelbe Kristalle mit einem Schmelzpunkt von 152°C.

### Beispiel 3:

15

### Verfahren c)

2,4 g (0,006 Mol) 3-Nitro-2-benzyloxy-N-[1-(4-fluorphenyl)-ethyl)-benzoesäure-amid werden mit 0,6 g 10% Palladium auf Kohle und 8 ml Wasser versetzt. Zu

dieser Mischung gibt man nacheinender 15 ml Ameisensäure und 0,9 g Zinn-Pulver und erhitzt anschließend 5 Stunden unter Rückfluß zum Sieden. Danach werden die festen Bestandteile abgesaugt, und das Filtrat mit Dichlormethan extrahiert. Die organische Phase wird über Natriumsulfat getrocknet und bei vermindertem Druck eingeengt. Man erhält 1,1 g (61 % der Theorie) 3-Formamido-2-hydroxy-N-[1-(4-fluorphenyl)-ethyl)-benzoesäureamid als Öl.

<sup>1</sup>H-NMR:(CDCl<sub>3</sub>/TMS):  $\delta = 1,62$  (d, 3H) ppm

### Herstellung der Ausgangsverbindung

### Beispiel (V-1):

P CH<sub>3</sub>

10

15

20

25

### Verfahren a-2)

Zu einer Lösung von 3 g (0,011 Mol) 3-Nitro-2-benzyloxybenzoesäure in 40 ml Dichlormethan gibt man bei -10°C 2,4 g (0,011 Mol) Triethylamin. Nach 5 Minuten Rühren werden bei -10°C 2,8 g (0,011 Mol) Chlorameisensäureisobutylester zugetropft und weitere 30 Minuten gerührt. Dann gibt man bei -10°C eine Lösung von 1,53 g (0,011 Mol) 1-(4-Fluorphenyl)-ethylamin in 10 ml Dichlormethan zu und rührt ohne weitere Kühlung 12 Stunden nach. Die Mischung wird mit Natriumhydrogencarbonat-Lösung versetzt, die organische Phase abgetrennt, mit Waser gewaschen und über Natriumsulfat getrocknet. Nach dem Abdestillieren des Lösungsmittels erhält man 2,5 g (56% der Theorie) 3-Nitro-2-benzyloxy-N-[1-(4-fluorphenyl)-ethyl)-benzoesäureamid als Öl.

<sup>1</sup>H-NMR:(CDCl<sub>3</sub>/TMS):  $\delta = 1,34$  (d, 3H) ppm

Analog den Herstellungsbeispielen 1 bis 3 sowie entsprechend der allgemeinen Beschreibung der erfindungsgemäßen Verfahren werden die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (I) erhalten:

# Tabelle 1:

$$R^1$$
  $N$   $A$   $R^2$   $(I)$ 

Bsp Nr.	$\mathbb{R}^1$	A	$\mathbb{R}^2$	phys. Daten
4	Н	-	CI	NMR**: 6,90-8,54 (m, 12H)
5	Н	-	O CF <sub>3</sub>	Fp.: 100°C
6	H	-CH <sub>2</sub> -		MS*: m/e = 270 (M <sup>+</sup> )
7	H	CH <sub>3</sub>	CI	NMR** 1,62 (d, 3H)
8	Н	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	OCH <sub>3</sub>	NMR**: 3,85 (s, 3H); 3,88 (s, 3H)
9	Н	CH₃		MS*: m/e = 284 (M <sup>+</sup> )
10	Н	CH₃	OCH <sub>3</sub>	NMR**: 1,61 (d, 3H)
11	Н	CH₃	OCH <sub>3</sub>	$MS^*: m/e = 314 (M^+)$
12	Н	CH₃	OCH <sub>3</sub>	NMR**: 1,24 (d, 3H)
13	Н	-CH <sub>2</sub> -		NMR**: 4,64 (d, 2H)

Bsp Nr.	R <sup>1</sup>	Α	$R^2$	phys. Daten
14	Н	-CH <sub>2</sub> -	OCH <sub>3</sub>	Fp.: 142°C
15	Н	CH <sub>3</sub>	CI	Fp.: 74°C
16	Н	CH₃	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NMR**: 1,62 (d, 3H)
17	Н	-	CI	logp.: 2,53
18	Н	-		MS*: m/e = 324 (M <sup>+</sup> )
19	H	-	CF <sub>3</sub>	MS*: m/e = 392 (M <sup>+</sup> )
20	Н	-	CI	MS*: m/e = 324 (M <sup>+</sup> -1)
21	H	-	CI CI CF <sub>3</sub>	MS*: m/e = 358 (M <sup>+</sup> )

# <u>Tabelle1</u> (Fortsetzung)

Bsp Nr.	R <sup>1</sup>	A	R <sup>2</sup>	phys. Daten
22	Н	_	CI	MS*: m/e = 333 (M <sup>+</sup> )
23	Н	-	NHCHO	MS*: m/e = 333 (M <sup>+</sup> )
24	Н	-	Cyclododecyl	$MS^*: m/e = 346 (M^+)$
25	Н	-	Н	logp.: 2,36
26	Н	-		logp.: 2,04
27	Н	-		logp.: 1,36
28	CH <sub>3</sub>	-	——CI	
29	CH <sub>3</sub>	-	CH <sub>3</sub>	logp.: 3,49
30	Н	-		logp.: 2,71

Bsp Nr.	R <sup>1</sup>	<b>A</b>	R <sup>2</sup>	phys. Daten
31	Н	-CH <sub>2</sub> -	CI CI	logp.: 2,86
32	Н	-CH <sub>2</sub> -	CI	logp.: 2,44
33	Н	CH₃	CI	<sup>1</sup> H-NMR**: 1,64 (d,3H)
34	Н	-CH <sub>2</sub> -	CI CF <sub>3</sub>	logp.: 2,94
35	Н	-CH <sub>2</sub> -	————F	Fp.: 103°C
36	Н	-CH <sub>2</sub> -	cı	logp.: 2,46
37	Н	-CH <sub>2</sub> -	—CH <sub>3</sub>	logp.: 2,36
38	Н	-CH <sub>2</sub> -	—(C(CH3)3	logp.: 3,22

Bsp Nr.	$\mathbb{R}^1$	Α	$R^2$	phys. Daten
39	Н	-CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	Fp.: 110°C
40	Н	-CH <sub>2</sub> -	-CF <sub>3</sub>	logp.: 2,65
41	Н	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		Fp.: 140°C
42	Н	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	—————F	logp.: 2,32
43	Н	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	—————————————————————————————————————	logp.: 2,59
44	Н	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	CI	MS*: m/e = 352 (M <sup>+</sup> )
45	Н	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		logp.: 2,57
46	H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	CI	
47	Н	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	$- \left( \begin{array}{c} \\ \\ \end{array} \right) - \left( \begin{array}{c} \\ \\ \end{array} \right) - C_2 H_5$	logp.: 5,26

# <u>Tabelle1</u> (Fortsetzung)

Bsp Nr.	$\mathbb{R}^1$	Α	$R^2$	phys. Daten
48	Н	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	—(C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	logp.: 3,50
49	Н	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	CI	logp.: 3,55
50	Н	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	CI	MS*: m/e = 410 (M <sup>+</sup> )
51	Н	CH <sub>3</sub>		logp.: 2,62
52	Н	CH₃	CI	logp.: 3,03
53	Н	CH₃	−√∑−cH₃	logp.: 2,62
54	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	logp.: 2,59
55	Н	CH <sub>3</sub>	CI CI	

Bsp Nr.	$\mathbb{R}^1$	A	$\mathbb{R}^2$	phys. Daten
56	Н	CH₃	CF <sub>3</sub>	logp.: 2,85
57	Н	CH₃	OCH <sub>3</sub>	logp.: 2,02
58	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	logp.: 3,09
59	Н	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub> OCH <sub>3</sub> OCH <sub>3</sub>	
60	H	CH₃	-√_SO₂CH₃	NMR**: 3,05 (s, 3H)
61	Н	CH <sub>3</sub>	$-$ OC $_2$ H $_5$	
62	Н	CH₃		logp.: 3,27
63	Н	CH3	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	logp.: 3,51

Tabelle1 (Fortsetzung)

Bsp Nr.	$\mathbb{R}^1$	A	$\mathbb{R}^2$	phys. Daten
64	Н	CH₃	-\(\)_N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
65	Н	CH₃	——NH CH₃	
66	Н	CH₃	CH <sub>3</sub>	logp.: 2,92
67	Н	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	logp.: 2,92
68	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	——————————————————————————————————————	•
69	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	————och³	
70	H	CH <sub>3</sub>		logp.: 3,14
71	Н	CH <sub>3</sub>		logp.: 3,06
72	Н	ÇH₃	CI	

Bsp Nr.	R <sup>1</sup>	A	$R^2$	phys. Daten
73	Н	CH <sub>3</sub>		
74	Н	-CH <sub>2</sub> -	CH₃	logp.: 2,38
75	Н			
76	Н	-	CI	logp.: 2,52
77	Н	-	F	logp.: 2,11
78	Н	-	——————————————————————————————————————	logp.: 2,18
79	Н	-	——————————————————————————————————————	logp.: 2,34
80	Н	-	CH₃	logp.: 2,33

Bsp Nr.	R <sup>1</sup>	A	$\mathbb{R}^2$	phys. Daten
81	Н	<b>-</b>	CF <sub>3</sub>	logp.: 2,79
82	Н	-	CI CI	logp.: 2,23
83	Н	<del>-</del>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	logp.: 3,32
84	Н	-	————och3	
85	Н	-	OCH <sub>3</sub>	
86	Н	-		logp.: 3,07
87	Н	-	CF <sub>3</sub>	logp.: 3,68
88	Н	-		logp.: 2,24

# <u>Tabelle1</u> (Fortsetzung)

Bsp Nr.	R <sup>1</sup>	A	$R^2$	phys. Daten
<b>8</b> 9	Н	-		logp.: 2,35
90	H			MS*: m/e = 326 (M <sup>+</sup> )
91	Н	-		
92	Н	-		logp.: 3,07
93	Н	-		NMR**: 5,30 (s, 2H)
94	Н	-		logp.: 3,12
95	Н	• •	O CF <sub>3</sub>	logp.: 3,69

Bsp Nr.	$\mathbf{R}^1$	A	$\mathbb{R}^2$	phys. Daten
96	Н	<del>-</del>	O CF <sub>3</sub>	
97	Н	-	CI	logp.: 3,60
98	Н	<del>-</del>	CI	logp.: 3,56
99	Н	-	CI	logp.: 3,28
100	Н	-	CH <sub>3</sub>	logp.: 3,41
101	H	-	CH <sub>3</sub>	logp.: 3,39 .
102	Н	-	OCH <sub>3</sub>	
103	Н	-	OCH <sub>3</sub>	

Bsp Nr.	R <sup>1</sup>	A	$R^2$	phys. Daten
104	Н	<del>-</del>	OCHF <sub>2</sub>	
105	Н	<del>-</del>	CI	
106	Н	· -	CI OCH <sub>3</sub>	
107	Н	-	CI	logp.: 3,60
108	H	-	CI	
109	Н	-	CH <sub>3</sub>	logp.: 3,46
110	Н	•	CH <sub>3</sub>	logp.: 3,47
111 -	H	-	CH <sub>3</sub>	

Bsp Nr.	$\mathbb{R}^1$	A	$\mathbb{R}^2$	phys. Daten
112	Н	•	OCH <sub>3</sub>	
113	Н	-	OCH3	
114	Н	<b>-</b>		
115	Н	-	OCHF <sub>2</sub>	
116	Н	-	CI	
117	Н	-	CI	
118	Н	-	CI CH <sub>3</sub>	

# <u>Tabelle1</u> (Fortsetzung)

Bsp Nr.	R <sup>1</sup>	Α	$\mathbb{R}^2$	phys. Daten
119	H	-	OCH <sub>3</sub>	
120	Н	<u>-</u>	CH <sub>3</sub>	
121	Н	· -	CH <sub>3</sub>	
122	Н	-	CH <sub>3</sub>	logp.: 3,87
123	Н	-	CH <sub>3</sub>	NMR**: 2,23 (s, 3H)
124	Н	-*	CH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>	logp.: 3,74
125	Н	-	CH <sub>3</sub> OCH <sub>3</sub>	

Bsp Nr.	R <sup>1</sup>	Α	$R^2$	phys. Daten
126	Н	-	CH <sub>3</sub> O CF <sub>3</sub>	
127	Н	<del>-</del> +	CH <sub>3</sub>	
128	Н	4	CI OCF <sub>3</sub>	
129	Н	-	CF <sub>3</sub>	
130	Н	-	OCHF <sub>2</sub>	
131	Н	-		logp.: 3,05
132	Н	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		logp.: 3,20
133	Н	CH <sub>3</sub> (R+)		logp.: 2,26

## <u>Tabelle1</u> (Fortsetzung)

Bsp Nr.	R <sup>1</sup>	Α	R <sup>2</sup>	phys. Daten
134	Н	CH <sub>3</sub>		logp.: 2,26
135	Н	-		logp.: 2,73
136	Н	-CH <sub>2</sub> -		logp.: 3,20
137	Н	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -		logp.: 2,45
138	H	CH <sub>3</sub> (R+)	CI	logp.: 2,70
139	H	H	CI	logp.: 2,82
140	Н	CH <sub>3</sub> (R+)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	logp.: 2,96
141	Н	-		logp.: 2,88

# Tabelle1 (Fortsetzung)

Bsp Nr.	$\mathbb{R}^1$	A	$\mathbb{R}^2$	phys. Daten
142	Н	-	F <sub>3</sub> C	logp.: 2,74
143	Н	<del>-</del>	CI CI	logp.: 2,98
144	Н	-		logp.: 3,00
145	Н	-		logp.: 2,66
146	Н	-	H <sub>3</sub> C′ ————Br	logp.: 2,59
147	Н	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	F' CI	logp.: 3,06
148	Н	-	— ОН	logp.: 1,30
149	Н	-	F	logp.: 1,96

# Tabelle1 (Fortsetzung)

Bsp Nr.	$\mathbb{R}^1$	A	$R^2$	phys. Daten
150	Н	<b>-</b>	CI	NMR**: 12,43 (s, 1H)
151	<b>H</b>	-	CI CI	logp.: 2,68
152	Н	-	CH <sub>3</sub>	logp.: 3,76 Fp.: 155°C
153	Н	-	O CH <sub>3</sub>	logp.: 3, 76 Fp.: 153°C
154	Н	-	GI 13	logp.: 3,18
155	Н	-	CH <sub>3</sub>	logp.: 3,73
156	Н	-	CH <sub>3</sub>	logp.: 3,66

- \* Massenspektrum
- \*\* Die <sup>1</sup>H-NMR:-Spektren wurden in Deuterochloroform (CDCl<sub>3</sub>) oder Hexadeuterodimethylsulfoxid (DMSO-D<sub>6</sub>) mit Tetramethylsilan (TMS) als innerem Standard aufgenommen. Angegeben ist die chemische Verschiebung als δ-Wert in ppm.

Analog des Herstellungsbeispieles (II-1) sowie entsprechend der allgemeinen Beschreibung der erfindungsgemäßen Verfahren a-1a) und a-1b) werden die in der nachstehenden Tabelle 2 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (II) erhalten:

Tabelle 2:

Tabelle 2 (Fortsetzung)

Bsp Nr.	A	$\mathbb{R}^2$	phys. Daten
(II-7)	•	O CF <sub>3</sub>	HPLC***: Rf = 908
(II-8)	-	CI	NMR**: 7,71 (s, 1H)
(II-9)	-	CI	logp.: 2,70
(II-10)	-	F	logp.: 2,91
(II-11)	,	CH <sub>3</sub>	logp.: 3,55
(II-12)		CH <sub>3</sub>	logp.: 3,54
(II-13)	-	O C F	<sup>1</sup> H-NMR**: 6,65-9,05 (m, 12H)
(II-14)	-	CH <sub>3</sub>	logp.: 3,49
		CH <sub>3</sub>	

- \* Massenspektrum
- \*\* Die <sup>1</sup>H-NMR:-Spektren wurden in Deuterochloroform (CDCl<sub>3</sub>) oder Hexadeuterodimethylsulfoxid (DMSO-D<sub>6</sub>) mit Tetramethylsilan (TMS) als innerem Standard aufgenommen. Angegeben ist die chemische Verschiebung als δ-Wert in ppm.
- \*\*\* In der HPLC-Analyse wird der Retentionsindex (Rf) auf Basis der 2-Alkanone (C-3 C-16) auf einer C<sub>18</sub>-reversed Phase-HPLC mit dem Gradientensystem Phosphorsäure (0,1%ig)/Acetonitril erstellt.

Analog des Herstellungsbeispieles (V-1) sowie entsprechend der allgemeinen Beschreibung des erfindungsgemäßen Verfahrens a-2) werden die in der nachstehenden Tabelle 3 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (V) erhalten:

Tabelle 3:

Tabelle 3: (Fortsetzung)

BspNr.	Α	R <sup>2</sup>	phys. Daten
(V-10)	-	CI	Fp.: 138°C
(V-11)	-CH <sub>2</sub> -	OCH <sub>3</sub>	Fp.: 114°C
(V-12)	· <b>-</b>	CH <sub>3</sub>	logp.: 4,75
(V-13)	-CH <sub>2</sub> -	F	Fp.: 138°C
(V-14)	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	CI	Fp.: 119°C
(V-15)	-CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	Fp.: 92°C
(V-16)	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	logp.: 4,73
(V-17)	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	CI	Fp.: 84°C
(V-18)	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	——————————————————————————————————————	Fp.: 125°C
(V-19)	-CH <sub>2</sub> -	-CI	Fp.: 146°C

Tabelle 3: (Fortsetzung)

BspNr.	A	'R <sup>2</sup>	phys. Daten
(V-20)	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	——F	Fp.: 98°C
(V-21)	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	CI	Fp.: 108°C
(V-22)	<b>-</b>	—(H)	Fp.: 123°C
(V-23)	-	$\overline{}$	Fp.: 146°C
(V-24)	-	$\overline{}$	Fp.: 108°C
(V-25)	-		Fp.: 111°C
(V-26)	-		Fp.: 78°C
(V-27)	-	Cyclodedecyl	Fp.: 130°C
(V-28)	CH <sub>3</sub>	————cı	logp.: 3,94
(V-29)	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	CI	logp.: 3,85

Tabelle 3: (Fortsetzung)

BspNr.	A	$\mathbb{R}^2$	phys. Daten
(V-30)	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	−√CH₃	logp.: 3,84
(V-31)	-CH <sub>2</sub> -	CI	logp.: 3,68
(V-32)	-CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	logp.: 4,16
(V-33)	-CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>	logp.: 3,64
(V-34)	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	logp.: 4,04
(V-35)	CH₃	——————————————————————————————————————	logp.: 4,73
(V-36)	CH₃	H <sub>3</sub> C CH <sub>3</sub>	logp.: 4,19
(V-37)	CH₃	CI CI	logp.: 4,29

Tabelle 3: (Fortsetzung)

BspNr.	A	$R^2$	phys. Daten
(V-38)	CH <sub>3</sub>		logp.: 3,96
(V-39)	-CH <sub>2</sub> -	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	logp.: 4,53
(V-40)	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Fp.: 111°C
(V-41)	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	logp.: 3,87
(V-42)	-CH <sub>2</sub> -		logp.: 4,21
(V-43)	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	$ C_2H_5$	logp.: 6,30
(V-44)	CH <sub>3</sub>		Fp.: 92°C
(V-45)	CH <sub>3</sub>	———so₂cH₃	Fp.: 45°C
(V-46)	CH <sub>3</sub>	—————————————————————————————————————	Fp.: 89°C

Tabelle 3: (Fortsetzung)

BspNr.	Α	$\mathbb{R}^2$	phys. Daten
(V-47)	CH <sub>3</sub>		Fp.: 120°C
(V-48)	CH <sub>3</sub>		Fp.: 113°C
(V-49)	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub> O	Fp.: 121°C
(V-50)	CH₃	H <sub>3</sub> C CH <sub>3</sub>	Fp.: 104°C
(V-51)	CH <sub>3</sub> (R+)		Fp.: 118°C
(V-52)	-		Fp.: 125°C
(V-53)	CH <sub>3</sub> (R+)	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Fp.: 106°C
(V-54)	. <del>-</del>		logp.: 4,37

Tabelle 3: (Fortsetzung)

BspNr.	A	$\mathbb{R}^2$	phys. Daten
(V-55)	<u>.</u>	——F	logp.: 3,55
(V-56)	-	CF <sub>3</sub>	logp.: 4,22
(V-57)	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -	CI CI	logp.: 4,37
(V-58)	-	CI CI	logp.: 4,55
(V-59)	-CH <sub>2</sub> -	CI	logp.: 4,20
(V-60)	-	CH <sub>3</sub>	logp.: 4,77
(V-61)	<b>-</b>	CI	logp.: 4,75
(V-62)	-		logp.: 3,88

Tabelle 3: (Fortsetzung)

BspNr.	A	$\mathbb{R}^2$	phys. Daten
(V-63)	<u>-</u>		logp.: 4,32
(V-64)	-	CI	logp.: 4,06
(V-65)	٠-	CI	logp.: 4,03
(V-66)	-	CF <sub>3</sub>	logp.: 4,16
(V-67)	<b>-</b>	CI CI	logp.: 4,50
(V-68)	-,		logp.: 4,60
V-69)	-		logp.: 4,46

Tabelle 3: (Fortsetzung)

BspNr.	Α	$\mathbb{R}^2$	phys. Daten	
(V-70)			logp.: 4,42	
(V-71)	-	H <sub>3</sub> C	logp.: 3,62	
(V-72)	<u>-</u> *	Br	logp.: 4,33	
(V-73)	-	CI	logp.: 5,76	
(V-74)	-	F	logp.: 3,68	
(V-75)	•	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	logp.: 4,74	
(V-76)	-		logp.: 4,32	

Tabelle 3: (Fortsetzung)

BspNr.	A	$\mathbb{R}^2$	phys. Daten
(V-77)	-CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>	logp.: 3,66
(V-78)	-CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	logp.: 3,95
(V-79)	* <u>-</u>	——СН <sub>3</sub>	logp.: 3,82
(V-80)	-	CI CI	logp.: 4,76
(V-81)	-	CI	NMR**: 5,09 (s, 2H)
(V-82)	-	—⟨□⟩CH₃	logp.: 4,41
(V-83)	-	CI	logp.: 4,97

Tabelle 3: (Fortsetzung)

BspNr.	Α	$\mathbb{R}^2$	phys. Daten
(V-84)	-	CI	logp.: 4,93
(V-85)	-		logp.: 3,88
(V-86)	-	CH <sub>3</sub>	logp.: 4,81
(V-87)	-	CH <sub>3</sub>	logp.: 4,80
(V-88)	-	CH <sub>3</sub>	logp.: 5,13
(V-89)	-	CF <sub>3</sub>	logp.: 4,97
(V-90)	-	CH <sub>3</sub>	logp.: 5,26
(V-91)	-	CH <sub>3</sub>	logp.: 5,29

Tabelle 3: (Fortsetzung)

BspNr.	A	$\mathbb{R}^2$	phys. Daten
(V-92)	-	CF <sub>3</sub>	logp.: 3,49
(V-93)	-	CI	logp.: 4,62
(V-94)		CH <sub>3</sub>	logp.: 5,03
(V-95)	-		logp.: 4,41

Analog des Herstellungsbeispieles (IV-a-1) sowie entsprechend der allgemeinen Beschreibung des erfindungsgemäßen Verfahrens b-1) werden die in der nachstehenden Tabelle 4 aufgeführten Verbindungen der allgemeinen Formel (IV-a) erhalten:

Tabelle 4

$$O_2N$$
 $N$ 
 $Z$ 
 $R^3$  (IV-a)

BspNr.	Z	R <sup>3</sup>	physikal. Daten
IV-a-2	•	Cyclododecyl	$MS^*$ : $m/e = 348 (M^+)$
IV-a-3	-	4-Trifluormethoxyphenyl	$MS^*$ : m/e = 342 ( $M^+$ )
IV-a-4	-	3-Trifluormethylphenyl	$MS^*$ : m/e = 326 ( $M^+$ )
IV-a-5	-	4-Trifluormethylphenyl	$MS^*$ : $m/e = 326 (M^+)$
IV-a-6	-	2-Trifluormethylphenyl	$MS^*$ : m/e = 326 ( $M^+$ )
IV-a-7	-	4-Dodecylphenyl	IR: 1660 cm <sup>-1</sup>
IV-a-8	-	3-(Difluorchlormethoxy)-phenyl	$MS^*$ : m/e = 358 ( $M^+$ )
<b>IV-a-</b> 9		3,4-(Difluormethoxy)-phenyl	$MS^*$ : $m/e = 390 (M^+)$
IV-a-10	-CH(CH <sub>3</sub> )-	Phenyl	$MS^*$ : $m/e = 272 (M^+$
			15)
IV-a-11	-CH <sub>2</sub> -	2-Chlorphenyl	$MS^*$ : m/e = 306.5
			$(M^+)$
IV-a-12	-CH <sub>2</sub> -	2 [[]11	) f ( )
1 V -a-12	-CH <sub>2</sub> -	2-Fluorphenyl	$MS^*$ : $m/e = 272 (M^+-18)$
	•		10)
IV-a-13	-CH <sub>2</sub> -	4-Methylphenyl	HPLC***: RF =
	<b>2</b> .	<b>y</b> 1 <b>y</b> -	855
IV-a-14	-CH <sub>2</sub> -	2,6-Dichlorphenyl	
IV-a-15	-CH <sub>2</sub> -	4-Methoxyphenyl	$MS^*$ : $m/e = 302 (M^+)$
	_		()

IV-a-16	-CH <sub>2</sub> -	4-Chlorphenyl	$MS^*$ : $m/e = 306 (M^+)$
IV-a-17	-CH <sub>2</sub> -	2,5-Dimethylphenyl	$MS^*$ : m/e = 300 ( $M^+$ )
IV-a-18	-CH <sub>2</sub> -	4-tButyl-phenyl	$MS^*$ : $m/e = 328 (M^+)$
IV-a-19	-CH(CH <sub>3</sub> )-	4-Chlorphenyl	$MS^*$ : m/e = 321 ( $M^+$ )
IV-a-20	-CH <sub>2</sub> -	3-Pyridyl	$MS^*$ : m/e = 273 ( $M^+$ )
IV-a-21	-CH <sub>2</sub> -	2-Pyridyl	$MS^*$ : m/e = 273 ( $M^+$ )
IV-a-22		0 F	$MS^*$ : m/e = 338 ( $M^+$ )
IV-a-23	- -		$MS^*$ : $m/e = 312 (M^+)$
IV-a-24	-	3,5-Bistrifluormethylphenyl	$MS^*$ : $m/e = 394 (M^+)$
IV-a-25	-	O CF <sub>3</sub>	logP.: 4,23
IV-a-26	-	4-Phenylphenyl	logP: 3,80
IV-a-27	-	CH <sub>3</sub>	logP: 4,06
IV-a-28	-	CH <sub>3</sub>	logP: 4,04

			•
IV-a-29	-	OCH <sub>3</sub>	MS*: m/e= 380 (M <sup>+</sup> )
			,
IV-a-30	-	2-Naphthyl	logP: 3,33
IV-a-31	-	2-Benzylphenyl	logP: 3,61
IV-a-32	-	3-Benzyloxyphenyl	logP: 3,64
IV-a-33	•	2-Phenoxyphenyl	logP: 4,60
IV-a-34	•	3-Phenoxyphenyl	logP: 4,46
IV-a-35	-	4-Phenoxyphenyl	logP: 4,42
IV-a-36	•	2,6-Dichlorphenyl	logP: 3,74
IV-a-37	-	4-Brom-2-fluorphenyl	logP: 4,33
IV-a-38	-	0	logP: 4,21
		CI	
***			
IV-a-39	-	CH <sub>3</sub>	logP: 4,30
IV-a-40	-	4-t-Butylphenyl	logP: 4,74
IV-a-41	-	4-Benzyloxyphenyl	logP: 3,65
IV-a-42	-CH <sub>2</sub> -	3-Methylphenyl	logP: 2,97
IV-a-43	-CH <sub>2</sub> -	4-Trifluormethylphenyl	logP: 3,23
IV-a-44	-	4-Trifluormethylphenyl	logp: 3,39
IV-a-45	-	3,5-Dichlorphenyl	logP: 3,70
IV-a-46	-	$\wedge$	$^{1}$ H-NMR**: $\delta =$
			12,5 ppm (s, 1H)
	*		

IV-a-47	CI	logP: 4,25
IV-a-48	CI	logP: 4,22
IV-a-49	α-Naphthyl	logD: 2.06
IV-a-50	u-ivapininyi	logP: 3,06 logP: 4,80
	CH <sub>3</sub>	10g1 : 4,00
IV-a-51	O CH <sub>3</sub>	logP: 4,81
IV-a-52	ĊН³	logP: 5,13
	CH₃	
IV-a-53	CF <sub>3</sub>	logP: 4,97
IV-a-54	CI I	logP: 4,62

IV-a-55

logP: 4,51

IV-a-56

logP: 4,53

IV-a-57

 $1H-NMR**: \delta = 12,4ppm (s, 1H)$ 

IV-a-58

logP: 4,39

IV-a-59

logP:4,40

IV-a-60

logP:3,80

IV-a-61

logP:3,72

# \* Massenspektrum

- Die <sup>1</sup>H-NMR-Spektren wurden in Deuterochloroform (CDCl<sub>3</sub>) oder Hexadeuterodimethylsulfoxid (DMSO-D<sub>6</sub>) mit Tetramethylsilan (TMS) als innerem Standard aufgenommen. Angegeben ist die chemische Verschiebung als δ-Wert in ppm.
- \*\*\* In der HPLC-Analyse wird der Retentionsindex (Rf) auf Basis der 2-Alkanone (C-3 C-16) auf einer C<sub>18</sub>-reversed Phase-HPLC mit dem Gradientensystem Phosphorsäure (0,1%ig)/Acetonitril erstellt.

- 94 -

#### Anwendungsbeispiele:

#### Beispiel: A

# Sphaerotheca-Test (Gurke) / protektiv

Lösungsmittel:

4.7 Gewichtsteile Aceton

Emulgator:

0,3 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit Konidien des Pilzes Sphaerotheca fuliginea bestäubt.

Die Pflanzen werden anschließend bei 23 bis 24°C und bei einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 75 % im Gewächshaus aufgestellt.

10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung.

Bei diesem Test zeigt z.B. die folgende Verbindung (5) der Herstellungsbeispiele bei einer Wirkstoffkonzentration von 100 ppm einen Wirkungsgrad von mehr als 80%.

#### Beispiel B

## Venturia-Test (Apfel) / protektiv

Lösungsmittel:

4,7 Gewichtsteile Aceton

Emulgator:

0,3 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung bis zur Tropfnässe besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wäßrigen Konidiensuspension des Apfelschorferregers Venturia inaequalis inokuliert und verbleiben dann 1 Tag bei 20°C und 100% relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei 20°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 70% aufgestellt.

12 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung.

Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen der Herstellungsbeispiele (2), (4), (5), (12) und (15) bei einer Wirkstoffkonzentration von 100 ppm einen Wirkungsgrad von mehr als 80 %.

## Beispiel C

## Pyricularia-Test (Reis) / protektiv

Lösungsmittel:

12,5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator:

0,3

Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und verdünnt das Konzentrat mit Wasser und der angegebenen Menge Emulgator auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Reispflanzen mit der Wirkstoffzubereitung bis zur Tropfnässe besprüht. 4 Tage nach dem Abtrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wäßrigen Sporensuspension von Pyricularia oryzae inokuliert. Anschließend werden die Pflanzen in einem Gewächshaus bei 100% rel. Luftfeuchtigkeit und 25°C aufgestellt.

4 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung des Krankheitsbefalls.

Bei diesem Test zeigt z.B. die folgende Verbindung (5) der Herstellungsbeispiele bei einer Wirkstoffkonzentration von 0,05 % einen Wirkungsgrad von mehr als 80 %.

## Beispiel: D

# Pseudocercosporella herpotrichoides-Test (Weizen) / protektiv

Lösungsmittel:

10 Gewichtsteile N-Methyl-pyrrolidon

Emulgator:

0,6

Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit besprüht man junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen an der Halmbasis mit Sporen von Pseudocercosporella herpotrichoides inokuliert.

Die Pflanzen werden in einem Gewächshaus bei einer Temperatur von ca. 10°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 80 % aufgestellt.

21 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung.

Bei diesem Test zeigt z.B. die folgende Verbindung (5) der Herstellungsbeispiele bei einer Wirkstoffaufwandmenge von 250 g/ha einen Wirkungsgrad von mehr als 80 %.

## Beispiel E

# Phytophthora-Test (Tomate) / protektiv

Lösungsmittel:

4,7 Gewichtsteile Aceton

Emulgator:

0,3 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung taufeucht besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wäßrigen Sporensuspension von Phytophthora infestans inokuliert.

Die Pflanzen werden in einer Inkubationskabine mit 100% relativer Luftfeuchtigkeit und ca. 20°C aufgestellt.

3 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung.

Bei diesem Test zeigen z.B. die folgenden Verbindungen 2, 4, 5, 10, 12 und 15 bei einer Wirkstoffkonzentration von 100 ppm einen Wirkungsgrad von über 80 %.

#### Beispiel F

# Plasmopara-Test (Reben) / protektiv

Lösungsmittel:

4,7 Gewichtsteile Aceton

Emulgator:

0,3 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wäßrigen Sporensuspension von Plasmopara viticola inokuliert und verbleiben dann 1 Tag in einer Feuchtkammer bei 20 bis 22°C und 100% relativer Luftfeuchtigkeit. Anschließend werden die Pflanzen 5 Tage im Gewächshaus bei 21°C und ca. 90% Luftfeuchtigkeit aufgestellt. Die Pflanzen werden dann angefeuchtet und 1 Tag in eine Feuchtkammer gestellt.

6 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung.

Bei diesem Test zeigen z.B. die Verbindungen 5, 15 und 16 bei einer Wirkstoffkonzentration von 100 ppm einen Wirkungsgrad von über 90 %.

#### Beispiel G

# Botrytis-Test (Bohne) / protektiv

Lösungsmittel:

4,7 Gewichtsteile Aceton

Emulgator:

0,3 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden auf jedes Blatt 2 kleine mit Botrytis einerea bewachsene Agarstücken aufgelegt. Die inokulierten Pflanzen werden in einer abgedunkelten, feuchten Kammer bei 20°C aufgestellt. 3 Tage nach der Inokulation wird die Größe der Befallsflecken auf den Blättern ausgewertet.

Bei diesem Test zeigen die Verbindungen 2, 3, 4, 5, 10, 12, 15 und 16 bei einer Wirkstoffkonzentration von 500 ppm einen Wirkungsgrad von 90%.

## Beispiel: H

#### Phaedon-Larven-Test

Lösungsmittel:

7 Gewichtsteile

Dimethylformamid

Emulgator:

1 Gewichtsteil

Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und der angegebenen Menge Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Kohlblätter (Brassica oleracea) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Meerrettichblattkäfer-Larven (Phaedon cochleariae) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100%, daß alle Käfer-Larven abgetötet wurden; 0% bedeutet, daß keine Käfer-Larven abgetötet wurden.

In diesem Test bewirkten z.B. die Verbindungen der Herstellungsbeispiele (V-34) und (47) bei einer beispielhaften Wirkstoffkonzentration von 0,01 % eine Abtötung von 100 % nach 7 Tagen, während die bekannte Verbindung (A) keine Abtötung zeigte.

## Beispiel: I

#### Plutella-Test

Lösungsmittel:

7 Gewichtsteile

Dimethylfomamid

Emulgator:

1 Gewichtsteil

Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und der angegebenen Menge Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Kohlblätter (Brassica oleracea) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Raupen der Kohlschabe (Plutella maculipennis) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, daß alle Raupen abgetötet wurden; 0 % bedeutet, daß keine Raupen abgetötet wurden.

In diesem Test bewirkten z.B. die Verbindungen der Herstellungsbeispiele (41), (39), (V-34), (14), (V-40), (V-51), (47), (131) und (37) bei einer beispielhaften Wirkstofkonzentration von 0,01 % eine Abtötung von 80 bis100 % nach 7 Tagen.

#### Beispiel J

## Spodoptera-Test

Lösungsmittel:

7 Gewichtsteile

Emulgator:

1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und der angegebenen Menge Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Kohlblätter (Brassica oleracea) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Raupen des Eulenfalters Spodoptera frugiperda besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

Nach der gewünschten Zeit wird die Wirkung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100%, daß alle Raupen abgetötet wurden; 0% bedeutet, daß keine Raupen abgetötet wurden.

Bei diesem Test zeigt z.B. die folgende Verbindung (47) bei einer beispielhaften Konzentration von 0,1 % nach 7 Tagen einen Abtötungsgrad von 85 %.

#### Beispiel K

# Nephotettix-Test

Lösungsmittel:

7 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator:

1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und der angegebenen Menge Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Reiskeimlinge (Oryza sativa) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Larven der Grünen Reiszikade (Nephotettix cincticeps) besetzt, solange die Keimlinge noch feucht sind.

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, daß alle Zikaden abgetötet wurden; 0 % bedeutet, daß keine Zikaden abgetötet wurden.

In diesem Test bewirkten z.B. die Verbindungen gemäß den Herstellungsbeispielen (39), (35) und (71) bei einer beispielhaften Wirkstoffkonzentration von 0,001 % eine Abtötung von 100 % nach 7 Tagen.

5

10

# Patentansprüche

1. Verwendung von Verbindungen der Formel (I),

 $R^1$  N N  $R^2$  (I)

in welcher

A für eine Einfachbindung oder für eine Alkylenkette steht,

R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxy steht,

R<sup>2</sup> für jeweils gegebenenfalls substituiertes Cyloalkyl, Cycloalkenyl, Aryl oder Heterocyclyl steht,

sich zur Bekämpfung von Schädlingen an Pflanzen und technischen Materialien,

2. Verbindungen der Formel (I)

$$R^1$$
  $N$   $N$   $A$   $R^2$   $(I)$ 

in welcher

A für eine Einfachbindung oder für gegebenenfalls substituiertes Alkylen steht,

R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxy steht,

R<sup>2</sup> für jeweils gegebenenfalls substituiertes Cyloalkyl, Cycloalkenyl, Aryl oder Heterocyclyl steht, wobei die Nitrogruppe als Substituent ausgenommen ist,

10

und die Verbindungen 3-(Formylamino)-2-hydroxy-N-{4-[2,4,6-tris-(1-methylpropyl)-phenoxy]-phenyl}-benzamid, N-{4-[3,5-Bis-(1,1-dimethylethyl)-phenoxy]-phenyl}-3-(formylamino)-2-hydroxy-benzamid, N-{4-[2,4-Bis-(1,1-dimethylethyl)-phenoxy]-phenyl}-3-(formylamino)-2-hydroxy-benzamid, N-{4-[2,6-Bis-(1-methylpropyl)-phenoxy]-phenyl}-3-(formylamino)-2-hydroxy-benzamid, 3-(Formylamino)-2-hydroxy-N-{4-[3-(trifluormethyl)-phenoxy]-phenyl}-3-(formylamino)-2-hydroxy-benzamid, N-{4-[4-(1,1-dimethylethyl)-phenoxy]-phenyl}-3-(formylamino)-2-hydroxy-N-(4-phenoxyphenyl)-benzamid, N-(4-Butylphenyl)-3-(formylamino)-2-hydroxy-benzamid und N-{3-chlor-4-(4-chlorphenoxy)phenyl}-3-(formylamino)-2-hydroxy-benzamid, 3-(Formylamino)-2-hydroxy-N-(phenylmethyl)-benzamid, 3-Formamido-salicylanilid und 3-(Formylamino)-2-hydroxy-N-(2-phenylethyl)-benzamid, ausgenommen sind.

- 3. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 2, in welcher
  - A für eine Einfachbindung oder für eine Alkylenkette mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,
- 20 R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,
  - für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Cyano, Carboxy, Phenyl (welches gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy substituiert ist), C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl substituiertes Cycloalkyl oder Cycloalkenyl mit 3 bis 12 Kohlenstoffatomen;

für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes Aryl mit 3 bis 12 Ringgliedern oder für Heterocyclyl mit 3 bis 8 Ringgliedern steht, wobei die möglichen

25

30

Substituenten vorzugsweise aus der nachstehenden Aufzählung ausgewählt sind:

Halogen, Cyano, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl;

5

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;

10

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkylalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

15

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

20

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Acylamino, N-Acyl-N-alkylamino, Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyl, Alkylsulfonyloxy, Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen;

25

jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Alkylen oder Dioxyalkylen mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen;

sowie jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch

Halogen, Cyano, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl;

5

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;

10

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

15

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

20

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Acylamino, N-Acyl-N-alkylamino, Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen;

25

jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Alkylen oder Dioxyalkylen mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen;

substituiertes Aryl, Aryloxy, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxy, Arylalkylthio, Aryloxyalkyl, Arylthioalkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylalkyl, Heterocyclylalkyloxy oder Heterocyclylalkylthio.

- 5 4. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 2, in welcher
  - A für eine Einfachbindung oder für Methylen, 1,1-Ethylen, 1,2-Ethylen 1,1-, 1,2-, 1,3- oder 2,2-Propylen, 1,1-, 1,2-, 1,3-, 1,4-, 2,2-, 2,3-Butylen oder 1,1-, 1,2- oder 1,3-(2-Methyl-propylen) steht,
  - R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy steht,
    - R<sup>2</sup> für jeweils gegebenenfalls einfach bis sechsfach durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Carboxy, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propyl, Methoxy-carbonyl oder Ethoxy-carbonyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclohexyl, Cyclohexyl, Cyclodecyl, Cyclooctyl, Cyclononyl, Cyclodecyl, Cycloundecyl, Cyclododecyl, Tetralinyl, Decalinyl, Cyclododecatrienyl, Indanyl, Norbornyl oder Adamantyl;

oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach substituiertes Phenyl, Naphthyl, Benzyl, Phenethyl, Furyl, Benzofuranyl, Pyrrolyl, Indolyl, Thienyl, Benzothienyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Thiazolyl, Isothiazolyl, Oxadiazolyl, Thiadiazolyl, Pyridyl, Chinolyl, Pyrimidyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl, Oxiranyl, Oxetanyl, Tetrahydrofuryl, Perhydropyranyl, Pyrrolidinyl, Piperidinyl oder Morpholinyl steht, wobei die möglichen Substituenten vorzugsweise aus der nachstehenden Aufzählung ausgewählt sind:

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl , Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Trifluo

10

15

20

ethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Formylamino, N-Formyl-N-methylamino, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl, der Ethoximinoethyl,

jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Tetramethylen (Butan-1,4-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

und/oder gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Formyl, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Formylamino, N-Formyl-N-methylamino, Methylamino, Ethylamino, n-oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl oder Ethoximinoethyl,

jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Tetramethylen (Butan-1,4-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy.

5

10

15

20

25

Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

substituiertes Phenyl, Phenoxy, Phenylalkyl, Phenylthio, Phenoxyalkyl, Phenylthioalkyl, Phenylalkyloxy oder Phenylalkylthio, mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den jeweiligen Alkylketten.

### 5 5. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 2, in welcher

- A für eine Einfachbindung oder für Methylen, 1,1-Ethylen, 1,2-Ethylen 1,1-, 1,2-, 1,3- oder 2,2-Propylen, 1,1-, 1,2-, 1,3-, 1,4-, 2,2-, 2,3-Butylen oder 1,1-, 1,2- oder 1,3-(2-Methyl-propylen) steht,
- R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy steht,
- 10 R<sup>2</sup> für jeweils gegebenenfalls einfach bis sechsfach durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Carboxy, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propyl, Methoxy-carbonyl oder Ethoxy-carbonyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclohetyl, Cyclooctyl, Cyclononyl, Cyclodecyl, Cycloundecyl, Cyclododecyl, Tetralinyl, Decalinyl, Cyclododecatrienyl, Indanyl, Norbornyl oder Adamantyl;

für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach substituiertes Phenyl, Naphthyl, Benzyl, Phenethyl, Furyl, Benzofuranyl, Pyrrolyl, Indolyl, Thienyl, Benzothienyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Thiazolyl, Isothiazolyl, Oxadiazolyl, Thiadiazolyl, Pyridyl, Chinolyl, Pyrimidyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl, Oxiranyl, Oxetanyl, Tetrahydrofuryl, Perhydropyranyl, Pyrrolidinyl, Piperidinyl oder Morpholinyl steht, wobei die möglichen Substituenten vorzugsweise aus der nachstehenden Aufzählung ausgewählt sind:

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Formyl, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluormethylthio,

25

20

Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Formylamino, N-Formyl-N-methylamino, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl oder Ethoximinoethyl,

jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Tetramethylen (Butan-1,4-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

und/oder gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Formyl, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl , Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluormethoxy, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Formylamino, N-Formyl-N-methylamino, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl oder Ethoximinoethyl,

jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Tetramethylen (Butan-1,4-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

5

10

15

20

25

10

15

20

25

Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

substituiertes Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Benzyl, Phenylethyl, Phenylpropyl, Benzyloxy, Benzylthio, Phenoxymethyl, Phenylthiomethyl oder Phenylthioethyl.

- 5 6. Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 2, in welcher
  - A für eine Einfachbindung oder für Methylen, 1,1-Ethylen, 1,2-Ethylen, 1,1-Propylen, 1,2-Propylen oder 2,2-Propylen steht,
  - R<sup>1</sup> für Wasserstoff steht,
  - R<sup>2</sup> für jeweils gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl, Cyclooctyl, Cyclononyl, Cyclodecyl, Cycloundecyl, Cyclododecyl, Tetralinyl, Decalinyl, Cyclododecatrienyl, Indanyl, Norbornyl oder Adamantyl;

für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach substituiertes Phenyl, Naphthyl, Furyl, Benzofuranyl, Pyrrolyl, Indolyl, Thienyl, Benzothienyl, Pyridyl, Chinolyl, Pyrimidyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl steht, wobei die möglichen Substituenten vorzugsweise aus der nachstehenden Aufzählung ausgewählt sind:

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluormethyl-thio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Formylamino, N-Formyl-N-methylamino, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethyl-

sulfonyloxy, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl, oder Ethoximinoethyl,

5

jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Tetramethylen (Butan-1,4-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

10

und/oder gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Formyl, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl , Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Formylamino, N-Formyl-N-methylamino, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl oder Ethoximinoethyl.

15

20

25

jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Tetramethylen (Butan-1,4-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

substituiertes Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Benzyl, Phenyl-1-ethyl, Phenyl-2-ethyl, Benzyloxy, Benzylthio, Phenoxymethyl oder Phenylthiomethyl.

 Schädlingsbekämpfungsmittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einer Verbindung der Formeln (I) und/oder (IVa) nach den Ansprüchen 1 und 13.

- 8. Verfahren zur Bekämpfung von Schädlingen, dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel (I) und/oder (IVa) nach Anspruch 1 und Anspruch 13 auf Schädlinge und/oder ihren Lebensraum einwirken läßt.
- Verfahren zur Herstellung von Schädlingsbekämpfungsmitteln, dadurch
   gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel (I) und/oder (IVa) nach den Ansprüchen 1 bis 6 und 13 bis 17 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Mitteln vermischt.
  - 10. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I)

10 worin

 $R^1$ , A und  $R^2$  die in Anspruch 2 angegebenen Bedeutungen haben, dadurch gekennzeichnet, daß man

a) Aminosalicylsäureamide der allgemeinen Formel (II),

$$H_2N$$
 $N$ 
 $A$ 
 $R^2$ 
(II)

in welcher

A und R<sup>2</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben, mit Acylierungsmitteln der allgemeinen Formel (III),

$$R^1$$
  $X^1$  (III)

in welcher

R<sup>1</sup> die oben angegebene Bedeutung hat und

X<sup>1</sup> für Halogen, Hydroxy, Alkoxy oder Alkylcarbonyloxy steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors, und gegebenenfalls in Gegenwart eines weiteren Reaktionshilfsmittels, umsetzt, oder daß man

b) Nitrosalicylsäureamide der allgemeinen Formel (IV)

$$O_2N$$
 $N$ 
 $A$ 
 $R^2$ 
(IV)

10

5

in welcher

A und R<sup>2</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Ameisensäure, gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators und gegebenenfalls in Gegenwart eines weiteren Reaktionshilfsmittels, umsetzt, oder wenn man

15

c) O-Benzyl-nitrosalicylsäureamide der allgemeinen Formel (V),

5

$$O_2N$$
 $A$ 
 $R^2$ 
 $(V)$ 

in welcher

A und R<sup>2</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Ameisensäure, gegebenenfalls in Gegenwart von Wasserstoff oder eines unedlen Metalls, gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators und gegebenenfalls in Gegenwart eines weiteren Reaktionshilfsmittels, umsetzt.

## 11. Verbindungen der Formel (II)

$$H_2N$$
 $N$ 
 $A$ 
 $R^2$ 
(II)

in welcher

A und R<sup>2</sup> die in Anspruch 2 angegebenen Bedeutungen haben mit Ausnahme von 4-{4-[(3-Amino-2-hydroxybenzoyl)-amino]-3-hydroxy-1-piperidyl}-N,N,4-trimethyl-2,2-diphenyl-butanamid.

### 15 12. Verbindungen der Formel (V)

$$O_2N$$
 $A R^2$ 
 $(V)$ 

in welcher A und R<sup>2</sup> die in Anspruch 2 angegebenen Bedeutungen haben.

### 13. Verbindungen der Formel (IVa)

$$O_2N$$
 $N$ 
 $Z$ 
 $R^3$ 
(IV-a)

5 in welcher

- Z für eine Einfachbindung oder für eine Alkylenkette steht und
- R<sup>3</sup> für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Aryl oder Heteroaryl mit bis zu 3 Heteroatomen, wobei die Nitrogruppe als Substituent ausgenommen ist, steht,

10

und die Verbindungen

N-[3-Chlor-4-(4-chlorphenoxy)phenyl]-2-hydroxy-3-nitro-benzamid,

N-(4-Decylphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid,

N-(3,4-Dimethylphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid,

15 3-Nitro-N-phenethyl-salicylamid,

N-Benzyl-3-nitro-salicylamid,

N-(4-Aminophenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid,

N-(2-Chlor-6-methylphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid, N-(3-Chlor-2-methylphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid, 2-Hydroxy-3-nitro-N-(2,4,6-trichlorphenyl)-benzamid N-(2,3-Dimethylphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid 5 N-(2-Ethylphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid. 2-Hydroxy-3-nitro-N-phenyl-benzamid, 2-Hydroxy-N-(4-methylphenyl)-3-nitro-benzamid 2-Hydroxy-N-(2-methylphenyl)-3-nitro-benzamid, 2-Hydroxy-N-(4-methoxyphenyl)-3-nitro-benzamid. 10 2-Hydroxy-N-(2-methoxyphenyl)-3-nitro-benzamid, 2-Hydroxy-N-(2-hydroxyphenyl)-3-nitro-benzamid, 2-Hydroxy-N-(2-hydroxyphenyl)-3-nitro-benzamide, 2-[(2-Hydroxy-3-nitrobenzoyl)amino]-benzoesäure. N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid, 15 N-(2,5-Dimethylphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid. 2-Hydroxy-3-nitro-N-[2-phenoxy-5-(trifluormethyl)phenyl]-benzamid, N-[2-Chlor-5-(trifluormethyl)phenyl]-2-hydroxy-3-nitro-benzamid. 2-Hydroxy-3-nitro-N-[4-(phenylazo)phenyl]-benzamid. N-(2,4-Dimethylphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid. 20 N-(5-Chlor-2-methoxyphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid N-(4-Chlor-2-methylphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid, N-(2-Chlor-4-methylphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid, N-(4-Brom-2-methylphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid, N-(4-Chlor-2,5-dimethoxyphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid, 25 N-(2,5-Dibromphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid. N-(2-Fluorphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid. N-(3-Fluorphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid. 2-Hydroxy-N-(2-iodphenyl)-3-nitro-benzamid,

2-Hydroxy-N-(3-iodphenyl)-3-nitro-benzamid, N-(2-Bromphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid, N-(3-Bromphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid. N-(2,5-Dichlorphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid. 5 N-(3,4-Dichlorphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid. 2',3',5'-Trichlor-6'-hydroxy-3-nitro-salicylanilid. N-(p-Hydroxy-a-methylphenethyl)-3-nitro-salicylamid, 3-Nitro-3',5'-bis(trifluormethoxy)-salicylanilid, N-(2,4-Dichlorphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid, 10 2-Hydroxy-N-(4-iodphenyl)-3-nitro-benzamid, N-(4-bromphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid, N-(2-Chlorphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid, N-(3-Chlorphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid, N-(4-Chlorphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid und 15 N-(4-Fluorphenyl)-2-hydroxy-3-nitro-benzamid ausgenommen sind.

- 14. Verbindungen der Formel (IV-a) gemäß Anspruch 13, in welcher
  - Z für eine Einfachbindung oder für eine Alkylenkette mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht,
- 20 R<sup>3</sup> für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Halogen, Cyano, Carboxy, Phenyl (welches gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy substituiert ist), C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl substituiertes Cycloalkyl oder Cycloalkenyl mit 3 bis 12 Kohlenstoffatomen;

für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden substituiertes Aryl mit 3 bis 12 Ringgliedern oder für Heterocyclyl mit 3 bis 8 Ringgliedern steht, wobei die möglichen Substituenten vorzugsweise aus der nachstehenden Aufzählung ausgewählt sind:

Halogen, Cyano, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl;

5

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;

10

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

15

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

20

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Acylamino, N-Acyl-N-alkylamino, Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen,

25

jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Alkylen oder Dioxyalkylen mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen;

sowie jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch

Halogen, Cyano, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl;

5

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoff-atomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;

10

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

15

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

20

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Acylamino, N-Acyl-N-alkyl-amino, Alkylamino, Dialkylamino, Alkylamino, Alkylamino, Alkylamino, Alkylamino, Alkylaminoalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen;

25

jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Alkylen oder Dioxyalkylen mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen:

substituiertes Aryl, Aryloxy, Arylthio, Arylalkyl, Arylalkyloxy, Arylalkylthio, Aryloxyalkyl, Arylthioalkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylalkyloxy, Heterocyclylalkylhio, Heterocyclylalkylhio.

- 5 15. Verbindungen der Formel (IV-a) gemäß Anspruch 13, in welcher
  - A für eine Einfachbindung oder für Methylen, 1,1-Ethylen, 1,2-Ethylen 1,1-, 1,2-, 1,3- oder 2,2-Propylen, 1,1-, 1,2-, 1,3-, 1,4-, 2,2-, 2,3-Butylen oder 1,1-, 1,2- oder 1,3-(2-Methyl-propylen) steht,
  - R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy steht,
    - R<sup>3</sup> für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Carboxy, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propyl, Methoxy-carbonyl oder Ethoxy-carbonyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclohexyl, Cyclohexyl, Cyclohexyl, Cycloddecyl, Cycloddecyl, Cycloddecyl, Tetralinyl, Decalinyl, Cycloddecatrienyl, Indanyl, Norbornyl oder Adamantyl;

oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach substituiertes Phenyl, Naphthyl, Benzyl, Phenethyl, Furyl, Benzofuranyl, Pyrrolyl, Indolyl, Thienyl, Benzothienyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Thiazolyl, Isothiazolyl, Oxadiazolyl, Thiadiazolyl, Pyridyl, Chinolyl, Pyrimidyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl, Oxiranyl, Oxetanyl, Tetrahydrofuryl, Perhydropyranyl, Pyrrolidinyl, Piperidinyl oder Morpholinyl steht, wobei die möglichen Substituenten vorzugsweise aus der nachstehenden Aufzählung ausgewählt sind:

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl , Trifluormethyl, Trifluormethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Triflu

20

15

10

25

ethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Formylamino, N-Formyl-N-methylamino, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl, oder Ethoximinoethyl,

jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Tetramethylen (Butan-1,4-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

und/oder gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Formyl, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Formylamino, N-Formyl-N-methylamino, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl, oder Ethoximinoethyl,

jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Tetramethylen (Butan-1,4-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy.

5

10

15

20

25

Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

substituiertes Phenyl, Phenoxy, Phenylalkyl, Phenylthio, Phenoxyalkyl, Phenylthioalkyl, Phenylalkyloxy oder Phenylalkylthio, mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den jeweiligen Alkylketten.

- 5 16. Verbindungen der Formel (IV-a) gemäß Anspruch 13, in welcher
  - A für eine Einfachbindung oder für Methylen, 1,1-Ethylen, 1,2-Ethylen 1,1-, 1,2-, 1,3- oder 2,2-Propylen, 1,1-, 1,2-, 1,3-, 1,4-, 2,2-, 2,3-Butylen oder 1,1-, 1,2- oder 1,3-(2-Methyl-propylen) steht,
  - R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Methoxy oder Ethoxy steht,
- 10 R<sup>3</sup> für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Carboxy, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propyl, Methoxy-carbonyl oder Ethoxy-carbonyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl, Cyclooctyl, Cyclononyl, Cyclodecyl, Cycloundecyl, Cycloddecyl, Tetralinyl, Decalinyl, Cyclododecatrienyl, Indanyl, Norbornyl oder Adamantyl;

für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach substituiertes Phenyl, Naphthyl, Benzyl, Phenethyl, Furyl, Benzofuranyl, Pyrrolyl, Indolyl, Thienyl, Benzothienyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Thiazolyl, Isothiazolyl, Oxadiazolyl, Thiadiazolyl, Pyridyl, Chinolyl, Pyrimidyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl, Oxiranyl, Oxetanyl, Tetrahydrofuryl, Perhydropyranyl, Pyrrolidinyl, Piperidinyl oder Morpholinyl steht, wobei die möglichen Substituenten vorzugsweise aus der nachstehenden Aufzählung ausgewählt sind:

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Formyl, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluorethyl,

20

methoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Formylamino, N-Formyl-N-methylamino, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl, oder Ethoximinoethyl,

jeweils gegebenenfalls einfach bis vie rfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Tetramethylen (Butan-1,4-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

und/oder gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Formyl, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl , Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Formylamino, N-Formyl-N-methylamino, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl, oder Ethoximinoethyl,

jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Tetramethylen (Butan-1,4-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

5

10

15

20

25

Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,

substituiertes Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Benzyl, Phenylethyl, Phenylpropyl, Benzyloxy, Benzylthio, Phenoxymethyl, Phenylthiomethyl oder Phenylthioethyl.

- 5 17. Verbindungen der Formel (IV-a) gemäß Anspruch 13, in welcher
  - A für eine Einfachbindung oder für Methylen, 1,1-Ethylen, 1,2-Ethylen, 1,1-Propylen, 1,2-Propylen oder 2,2-Propylen steht,
  - R<sup>1</sup> für Wasserstoff steht,
- für jeweils gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Methyl,

  Ethyl, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl,

  Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl, Cyclooctyl, Cyclononyl,

  Cyclodecyl, Cycloundecyl, Cyclododecyl, Tetralinyl, Decalinyl,

  Cyclododecatrienyl, Indanyl, Norbornyl oder Adamantyl;

für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach substituiertes Phenyl, Naphthyl, Furyl, Benzofuranyl, Pyrrolyl, Indolyl, Thienyl, Benzothienyl, Pyridyl, Chinolyl, Pyrimidyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl steht, wobei die möglichen Substituenten vorzugsweise aus der nachstehenden Aufzählung ausgewählt sind:

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluormethyl, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Formylamino, N-Formyl-N-methylamino, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethyl-

**2**0

15

sulfonyloxy, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl oder Ethoximinoethyl,

jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Tetramethylen (Butan-1,4-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

und/oder gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Formyl, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethylsulfonyl, Acetylamino, Formylamino, N-Formyl-N-methylamino, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl oder Ethoximinoethyl.

jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Tetramethylen (Butan-1,4-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

substituiertes Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Benzyl, Phenyl-1-ethyl, Phenyl-2-ethyl, Benzyloxy, Benzylthio, Phenoxymethyl oder Phenylthiomethyl.

30 18. Verwendung von Verbindungen der Formel (IV-a) wie in Anspruch 13 definiert zur Bekämpfung von Schädlingen.

5

10

15

20

Inten. nal Application No PCT/EP 96/03637

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 6 C07C237/44 C07C235/58 C07C235/64 C07C235/62 A01N37/18 A01N37/24 According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) IPC 6 C07C Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used) C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT Category Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages Relevant to claim No. χ JOURNAL OF PHARMACEUTICAL SCIENCES, 1-5,7-9 vol. 52, no. 6, 1963, WASHINGTON US, pages 542-545, XP002020731 siehe Tabelle 1 und 2, Verbindung X see page 544, left-hand column, line 5 see page 544, right-hand column, line 11 line 29 -/--Patent family members are listed in annex. Further documents are listed in the continuation of box C. Special categories of cited documents: later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance invention earlier document but published on or after the international "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to filing date document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) involve an inventive step when the document is taken alone document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such docudocument referring to an oral disclosure, use, exhibition or ments, such combination being obvious to a person skilled in the art. other means document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed  $% \left\{ 1,2,\ldots,n\right\}$ "&" document member of the same patent family Date of the actual completion of the international search Date of mailing of the international search report 18.12.96 10 December 1996 Name and mailing address of the ISA Authorized officer European Patent Office, P.B. 5818 Patentiaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Seufert, G Fax: (+31-70) 340-3016

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 1992)

Inter. .nal Application No PCT/EP 96/03637

0.00		PCT/EP 9	0/0303/
C.(Continua Category	ation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT  Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages		Palement to alaine No.
- Cawgory	Clearon of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages		Relevant to claim No.
X	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 122, no. 3, 16 January 1995 Columbus, Ohio, US; abstract no. 29879, SUZUKI, AKINORI ET AL.: "Pesticides TOD-4403 manufacture with streptomyces" page 792; XP002020733 siehe Zusammenfassung und 159812-89-2, 159698-61-0, 159698-60-9 & JP 06 239 844 A (KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY)		1,2,7-9
X	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 119, no. 15, 11 October 1993 Columbus, Ohio, US; abstract no. 158366, IMAMARU, NOBUTAKA ET AL.: "Fungicidal urauchimycin A und B and their manufacture with streptomyces species" XP002020734 siehe Zusammenfassung und 148163-08-0, 148163-07-9 & JP 05 255 877 A (KAIYO BAIO TEKUNOROJII KENKYUS)		1,2,7-9
X	BULLETIN OF THE CHEMICAL SOCIETY OF JAPAN, vol. 44, no. 12, 1971, TOKYO JP, pages 3395-9, XP002020732 MITSUHIRO KINOSHITA ET AL.: "Synthesis of (2S, 4R, 15S)-4,15-dimethyl-1,5-dioxa-3-(3'-formami dosalicylamido)cyclopentadecane-2,6-dione and its (15R)-epimer, new antimycin analogs" siehe Seite 3396, Verbindung 9a,9b, 10a,10b see page 3396, right-hand column, last paragraph - page 3397, left-hand column, line 2		1,2,7-9, 12
	-/	*	,
		*	

Inter. anal Application No
PCT/EP 96/03637

		PC1/EP 96/0363/
	ation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT	
Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 76, no. 1, 3 January 1972 Columbus, Ohio, US; abstract no. 1725, P. P. BATRA ET AL.: "Relation of structure and activity of antimycin A in the induction of carotenoid synthesis in mycobacterium marinum" page 169; XP002020735 siehe RN 34999-31-0, L-phenylalanine, N-[3-(formylamino)-2-hydroxybenzoyl]-, ethyl ester & J. BIOL. CHEM., vol. 246, no. 23, 1971, pages 7125-30,	2
X	JOURNAL OF CHROMATOGRAPHY, vol. 522, 1990, AMSTERDAM NL, pages 179-94, XP000611197 S. L. ABIDI ET AL.: "Liquid chromatography-thermospray mass spectrometric study of N-acylamino dilactones and 4-butyrolactones derived from antimycin A" see page 180 see page 181, last paragraph - page 182, line 6	2,11
X	US 3 148 995 A (J. B. HEMWALL) 15 September 1964 see column 4, line 45 - line 46	11
A	DE 21 26 149 A (FARBENWERKE BAYER) 7 December 1972 see claims; examples	1,7-9
<b>A</b> .	US 3 929 879 A (TABORSKY ROBERT G) 30 December 1975 see column 3, line 40 - column 6, line 12; claims	7-9,13, 18
A	FR 1 501 151 A (STECKER INTERNATIONAL) 26 January 1968 see page 1, left-hand column, line 1-7; claims; table I see page 15, left-hand column, line 29 - line 31	1,7-9

Information on patent family members

Inter. nal Application No PCT/EP 96/03637

Patent document cited in search report	Publication date	Patent fa membe		Publication date
US-A-3148995	15-09-64	NONE		
DE-A-2126149	07-12-72	NONE		
US-A-3929879	30-12-75	NONE		
FR-A-1501151	26-01-68	CH-A- DE-A- GB-A- NL-A- US-A-	485843 1593552 1167734 6616975 3455940	15-02-70 06-08-70 22-10-69 08-06-67 15-07-69

Intern: ales Aktenzeichen
PCT/EP 96/03637

A. KLASSI 1PK 6	ifizierung des anmeldungsgegenstandes C07C237/44 C07C235/58 C07C235/6 A01N37/24	64 C07C235/62 A01	LN37/18
Nach der In	ternationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen KI	assifikation und der IPK	
B. RECHE	RCHIERTE GEBIETE		
	ter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbo	ile)	
IPK 6	C07C		
Recherchier	te aber nicht zum Mindestprüßtoff gehörende Veröffentlichungen, so	weit diese unter die recherchierten Geb	iete fallen
			2(1) 76.)
Während de	r internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Na	ame der Datenbank und evu. Verweiter	ete Sucnoegniie)
C. ALS WI	ESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe	e der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
х	JOURNAL OF PHARMACEUTICAL SCIENCE Bd. 52, Nr. 6, 1963, WASHINGTON Seiten 542-545, XP002020731	US,	1-5,7-9
	siehe Tabelle 1 und 2, Verbindung siehe Seite 544, linke Spalte, Ze	.Χ ilo.5 -	
	Zeile 16	116 3	
	siehe Seite 544, rechte Spalte, Z	eile 11 -	
	Zeile 29		
		/	
	_	/	·
X Wei	l itere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu nehmen	X Siehe Anhang Patentfamilie	
	C ITHOUGHT TON MICHELIAN TO THE CONTRACT OF TH	"T" Spätere Veröffentlichung, die nach oder dem Prioritätsdatum veröffen	tlicht worden ist und mit der
aber	Tentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, nicht als besonders bedeutsarn anzusehen ist	Anmeldung nicht kollidiert, sonder Erfindung zugrundeliegenden Prin	rn nur zum Verständnis des der zips oder der ihr zugrundeliegenden
"E" älteres Anme	s Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen eldedatum veröffentlicht worden ist	Theorie angegeben ist "X" Veröffentlichung von besonderer B	edeutung; die beanspruchte Erfindung
schein	fentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft er- nen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer	kann allein aufgrund dieser Veröff erfinderischer Tätigkeit beruhend b	entlichung nicht als neu oder auf betrachtet werden
ander soll o	ren im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie	kann nicht als auf erfinderischer T	ätigkeit beruhend betrachtet
"O" Veröf	führt) fentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung,	Veröffentlichungen dieser Kategor	g mit einer oder mehreren anderen ie in Verbindung gebracht wird und
"P" Veröf	Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht fentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach	diese Verbindung für einen Fachm  *%" Veröffentlichung, die Mitglied der	
	beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist s Abschlusses der internationalen Recherche	Absendedatum des internationalen	Recherchenberichts
	10.Dezember 1996	18:12:96	
Name und	Postanschrift der Internationale Recherchenbehörde	Bevollmächtigter Bediensteter	
	Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk		
	Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016	Seufert, G	

Intern: ales Aktenzeichen
PCT/EP 96/03637

		PCT/EP 9	0/0303/
	ing) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kom	menden Teile	Betr. Anspruch Nr.
x	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 122, no. 3, 16.Januar 1995 Columbus, Ohio, US; abstract no. 29879, SUZUKI, AKINORI ET AL.: "Pesticides TOD-4403 manufacture with streptomyces" Seite 792; XP002020733 siehe Zusammenfassung und 159812-89-2, 159698-61-0, 159698-60-9 & JP 06 239 844 A (KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY)		1,2,7-9
<b>X</b> .	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 119, no. 15, 11.0ktober 1993 Columbus, Ohio, US; abstract no. 158366, IMAMARU, NOBUTAKA ET AL.: "Fungicidal urauchimycin A und B and their manufacture with streptomyces species" XP002020734 siehe Zusammenfassung und 148163-08-0, 148163-07-9 & JP 05 255 877 A (KAIYO BAIO TEKUNOROJII KENKYUS)		1,2,7-9
<b>X</b>	BULLETIN OF THE CHEMICAL SOCIETY OF JAPAN, Bd. 44, Nr. 12, 1971, TOKYO JP, Seiten 3395-9, XP002020732 MITSUHIRO KINOSHITA ET AL.: "Synthesis of (2S, 4R, 15S)-4,15-dimethyl-1,5-dioxa-3-(3'-formami dosalicylamido)cyclopentadecane-2,6-dione and its (15R)-epimer, new antimycin analogs" siehe Seite 3396, Verbindung 9a,9b, 10a,10b siehe Seite 3396, rechte Spalte, letzter Absatz - Seite 3397, linke Spalte, Zeile 2		1,2,7-9,

Intern. aales Aktenzeichen
PCT/EP 96/03637

		PUI/EP 9	
	ng) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht komme	enden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 76, no. 1, 3.Januar 1972 Columbus, Ohio, US; abstract no. 1725, P. P. BATRA ET AL.: "Relation of structure and activity of antimycin A in the induction of carotenoid synthesis in mycobacterium marinum" Seite 169; XP002020735 siehe RN 34999-31-0, L-phenylalanine, N-[3-(formylamino)-2-hydroxybenzoyl]-, ethyl ester & J. BIOL. CHEM., Bd. 246, Nr. 23, 1971, Seiten 7125-30,		2
X	JOURNAL OF CHROMATOGRAPHY, Bd. 522, 1990, AMSTERDAM NL, Seiten 179-94, XP000611197 S. L. ABIDI ET AL.: "Liquid chromatography-thermospray mass spectrometric study of N-acylamino dilactones and 4-butyrolactones derived from antimycin A" siehe Seite 180 siehe Seite 181, letzter Absatz - Seite 182, Zeile 6		2,11
X	US 3 148 995 A (J. B. HEMWALL) 15.September 1964 siehe Spalte 4, Zeile 45 - Zeile 46		11
A	DE 21 26 149 A (FARBENWERKE BAYER) 7.Dezember 1972 siehe Ansprüche; Beispiele		1,7-9
A	US 3 929 879 A (TABORSKY ROBERT G) 30.Dezember 1975 siehe Spalte 3, Zeile 40 - Spalte 6, Zeile 12; Ansprüche		7-9,13, 18
A	FR 1 501 151 A (STECKER INTERNATIONAL) 26.Januar 1968 siehe Seite 1, linke Spalte, Zeile 1-7; Ansprüche; Tabelle I siehe Seite 15, linke Spalte, Zeile 29 - Zeile 31		1,7-9

Formblatt PCT/ISA/210 (Fortsetzung von Blatt 2) (Juli 1992)

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Inten .ales Aktenzeichen
PCT/EP 96/03637

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
US-A-3148995	15-09-64	KEINE	
DE-A-2126149	07-12-72	KEINE	
US-A-3929879	30-12-75	KEINE	
FR-A-1501151	26-01-68	CH-A- 485843 DE-A- 1593552 GB-A- 1167734 NL-A- 6616975 US-A- 3455940	15-02-70 06-08-70 22-10-69 08-06-67 15-07-69

Formblatt PCT/ISA/218 (Anhang Patentfamilie)(Juli 1992)